

(19) 日本国特許庁 (J P)

## (12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平11-263775

(43) 公開日 平成11年(1999) 9月28日

(51) Int.Cl.<sup>6</sup> 識別記号

C 0 7 D 213/30

A 0 1 N 43/10

43/12

43/40

1 0 1

F I

C 0 7 D 213/30

A 0 1 N 43/10

43/12

43/40

C

Z

1 0 1 B

1 0 1 E

審査請求 未請求 請求項の数11 O L (全 43 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号 特願平10-252600

(22) 出願日 平成10年(1998) 9月7日

(31) 優先権主張番号 特願平9-242967

(32) 優先日 平9(1997) 9月8日

(33) 優先権主張国 日本 (J P)

(71) 出願人 000001856

三共株式会社

東京都中央区日本橋本町3丁目5番1号

(72) 発明者 佐藤 一雄

滋賀県野洲郡野洲町野洲1041 三共株式会  
社内

(72) 発明者 佐野 宏己

滋賀県野洲郡野洲町野洲1041 三共株式会  
社内

(72) 発明者 駒井 浩之

滋賀県野洲郡野洲町野洲1041 三共株式会  
社内

(74) 代理人 弁理士 大野 彰夫 (外2名)

最終頁に続く

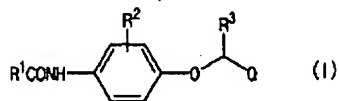
(54) 【発明の名称】 ヒドロキシアニリン誘導体

(57) 【要約】

【課題】 水稻に対する薬害を示さず、しかも水田の強害雑草であるタイヌビエに対し低薬量で優れた除草活性を示す化合物を見出すこと。

【解決手段】 一般式 (1)

【化1】

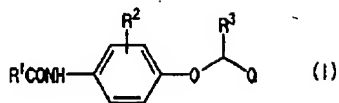


〔R<sup>1</sup>はC1～C4アルコキシ、R<sup>2</sup>はH、C1～C4アルキル、C3～C6シクロアルキル、C1～C4アルコキシ又はハロゲン、R<sup>3</sup>は、H又はC1～C2アルキル、Qは、複素環基(但し、オキサゾリル、2-ベンゾオキサゾリル、チアゾリル及び2-ベンゾチアゾリルを除く)で表されるヒドロキシアニリン誘導体又はその塩。〕

## 【特許請求の範囲】

【請求項1】下記一般式(I)

【化1】



〔式中、 $R^1$ は、C1～C4アルコキシ基を示し、 $R^2$ は、水素原子、C1～C4アルキル基、C3～C6シクロアルキル基、C1～C4アルコキシ基又はハロゲン原子を示し、 $R^3$ は、水素原子又はC1～C2アルキル基を示し、Qは、下記置換基群から任意に選ばれる1又は2個の置換基により置換されてもよい、少なくとも1個の酸素、硫黄若しくは窒素原子を含み、環原子数が5又は6であり、更にベンゼン環と縮合していてもよい複素環基(但し、オキサゾリル、2-ベンゾオキサゾリル、チアゾリル及び2-ベンゾチアゾリルを除く)を示し、置換基群は、ハロゲン原子、C1～C4アルキル基、C3～C6シクロアルキル基、C1～C4ハロアルキル基、C1～C4アルコキシ基、C3～C6シクロアルコキシ基、C1～C4ハロアルコキシ基、C1～C4アルキルチオ基、C3～C6シクロアルキルチオ基、C1～C4ハロアルキルチオ基、C1～C4アルキルスルホニル基、1又は2個のハロゲン原子により置換されてもよいフェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、シアノ基、ニトロ基及びC2～C5アルコキシカルボニル基からなる群を示す。〕で表されるヒドロキシアニリン誘導体又はその塩。

【請求項2】Qが、下記置換基から任意に選ばれる1又は2個の置換基により置換されてもよい、下記複素環群から選ばれる1つの複素環基であり、置換基群は、ハロゲン原子、C1～C4アルキル基、C3～C6シクロアルキル基、C1～C4ハロアルキル基、C1～C4アルコキシ基、C3～C6シクロアルコキシ基、C1～C4ハロアルコキシ基、C1～C4アルキルチオ基、C3～C6シクロアルキルチオ基、C1～C4ハロアルキルチオ基、C1～C4アルキルスルホニル基、1又は2個のハロゲン原子により置換されてもよいフェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、シアノ基、ニトロ基及びC2～C5アルコキシカルボニル基からなる群を示し、複素環群は、ピリダジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、チエニル、フラニル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、1,2,3-トリアゾリル、1,2,4-トリアゾリル、1,2,3-チアジアゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,2,5-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、インドリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾチオフェニル、2-ベンゾオキサゾリルを除くベンゾオキサゾリル、2-ベンゾチアゾリルを除くベンゾチアゾリル、

2-ベンゾチアゾリルを除くベンゾチアゾリル、1,2,3-ベンゾトリアゾリル、1,2,3-ベンゾチアジアゾリル、キノリル、キノキサリル、キナゾリル、チアゾロ[5,4-c]ピリジニル、チアゾロ[5,4-b]ピリジニル、イミダゾロ[1,2-a]ピリジニル、オキサゾロ[4,5-b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル及びベンゾジオキサソラニルからなる群を示す、請求項1に記載のヒドロキシアニリン誘導体又はその塩。

【請求項3】Qが、下記置換基から任意に選ばれる1又は2個の置換基により置換されてもよい、下記複素環群から選ばれる1つの複素環基であり、置換基群は、塩素原子、フッ素原子、メチル基、エチル基、n-ブチル基、シクロプロピル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、メチルチオ基、シクロヘキシルチオ基、メタンスルホニル基、フェニル基、2-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、シアノ基、ニトロ基、メトキシカルボニル基及びエトキシカルボニル基からなる群を示し、複素環群は、ピリジニル、ピラジニル、チエニル、フラニル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、1,2,4-チアジアゾリル、1,3,4-チアジアゾリル、1,2,4-オキサジアゾリル、1,3,4-オキサジアゾリル、インドリル、ベンゾチオフェニル、2-ベンゾオキサゾリルを除くベンゾオキサゾリル、2-ベンゾチアゾリルを除くベンゾチアゾリル、1,2,3-ベンゾトリアゾリル、キノリル、キノキサリル、チアゾロ[5,4-c]ピリジニル、オキサゾロ[4,5-b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル及びベンゾジオキサソラニルからなる群を示す、請求項1に記載のヒドロキシアニリン誘導体又はその塩。

【請求項4】Qが、2-ピリジニル、3-メチル-2-ピリジニル、4-メチル-2-ピリジニル、5-メチル-2-ピリジニル、4,6-ジメチル-2-ピリジニル、5-エチル-2-ピリジニル、2-メトキシ-3-ピリジニル、2,6-ジメトキシ-3-ピリジニル、2-クロロ-3-ピリジニル、6-クロロ-2-ピリジニル、6-クロロ-3-ピリジニル、5-シアノ-2-ピリジニル、5-メトキシカルボニル-2-ピリジニル、5-メチル-2-ピラジニル、2-チエニル、3-チエニル、3-メチル-2-チエニル、4-メチル-2-チエニル、5-メチル-2-チエニル、5-エチル-2-チエニル、4-メトキシ-2-チエニル、5-クロロ-2-チエニル、3-クロロ-4-メチル-2-チエニル、2,5-ジクロロ-3-チエニル、4,5-ジクロロ-2-チエニル、4,5-ジブromo-2-チエニル、5-メチルチオ-2-チエニル、5-シアノ-2-チエニル、3-フラニル、5-メチル-2-フラニル、3-メチル-5-イソオキサゾリル、5-メチル-3-イソオキサゾリル、3-n-ブチル-5-イソオキサゾリル

ル、3-フェニルイソオキサゾール-5-イル、4, 5-ジクロロ-3-イソチアゾリル、1, 5-ジメチル-3-ピラゾリル、1-フェニル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル、1-フェニル-3-(1, 1, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-5-イル、1-(4-クロロフェニル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル、5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、5-メチルチオ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、5-メタンスルホニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、5-フェニル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル、5-フェニル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、3-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1-メチル-5-インドリル、2-ベンゾチオフェニル、3-メチル-2-ベンゾチオフェニル、5-メチル-2-ベンゾチオフェニル、2-メチル-4-ベンゾオキサゾリル、2-メチル-5-ベンゾオキサゾリル、6-ベンゾオキサゾリル、2-メチル-7-ベンゾオキサゾリル、2-メチル-5-ベンゾチアゾリル、2-エチル-5-ベンゾチアゾリル、6-ベンゾチアゾリル、2-メチル-6-ベンゾチアゾリル、2-エチル-6-ベンゾチアゾリル、2-シクロプロピル-6-ベンゾチアゾリル、2-トリフルオロメチル-6-ベンゾチアゾリル、1-メチル-1, 2, 3-ベンゾトリアゾール-5-イル、2-キノリル、2-キノキサリル、チアゾロ[5, 4-c]ピリジン-6-イル、オキサゾロ[4, 5-b]ピリジン-2-イル、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル及び2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキサラン-5-イルである請求項1に記載のヒドロキシアニリン誘導体又はその塩。

【請求項5】 $R^1$ が、C1~C2アルコキシ基である請求項1乃至4のいずれかに記載のヒドロキシアニリン誘導体又はその塩。

【請求項6】 $R^1$ が、メトキシ基である請求項1乃至4のいずれかに記載のヒドロキシアニリン誘導体又はその塩。

【請求項7】 $R^2$ が、水素原子、C1~C4アルキル基又はハロゲン原子である請求項1乃至6のいずれかに記載のヒドロキシアニリン誘導体又はその塩。

【請求項8】 $R^2$ が、水素原子又はメチル基である請求項1乃至6のいずれかに記載のヒドロキシアニリン誘導体又はその塩。

【請求項9】 $R^3$ が、水素原子又はメチル基である請求項1乃至8のいずれかに記載のヒドロキシアニリン誘導体又はその塩。

【請求項10】メチル [4-(5-エチルピリジン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート、メチル [2-メチル-4-(5-メチルチオフェ

ン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート、メチル [2-メチル-4-(3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート、メチル [2-メチル-4-(3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート、メチル [4-(5-メチルチオ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート、メチル [2-メチル-4-(5-メチルチオ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート、メチル [4-(ベンゾチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート、メチル [4-(ベンゾチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート、メチル [2-メチル-4-(キノリン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート、メチル [4-(5-シアノピリジン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート、メチル [4-(4, 5-ジクロロチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート、メチル [2-メチル-4-(4-メチルチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート、メチル [4-(5-エチルチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート、メチル [2-メチル-4-(5-メチルベンゾチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート、メチル [4-(2-エチルベンゾチアゾール-6-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート及びメチル [2-メチル-4-(2-トリフルオロメチルベンゾチアゾール-6-イルメトキシ)フェニル]カルバマートからなる群から選ばれる、請求項1乃至9のいずれかに記載されたヒドロキシアニリン誘導体又はその塩。

【請求項11】請求項1乃至10のいずれかに記載された、1種又は2種以上のヒドロキシアニリン誘導体又はその塩を有効成分として含有する水田除草剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、優れた除草活性を有する新規なヒドロキシアニリン誘導体及び該化合物を有効成分とする除草剤に関する。

【0002】

【従来の技術】従来より、作物に対して薬害を与えず有害雑草のみを選択的に枯殺する除草剤が要望されている。又、種々研究された結果、多くの選択的除草剤が公表されているが、さらに優れた除草剤の出現が望まれている。

【0003】

米国特許4193787号及び米国特許4423237号には、除草活性を有するカルバミド酸誘導体が記載されているが、部分構造として1, 4-ベンゾジオキササン環を有することを必須の特徴としており、本願化合物とは化学構造を異にする。また、特開昭57

ー64675号公報、特開昭57-106667号公報及び特開昭58-52280号公報には、除草活性を有するキノリン誘導体、ベンゾイミダゾール誘導体及びベンゾチアゾール誘導体がそれぞれ記載されているが、それらはいずれもウレアを部分構造として有することを必須の特徴としており、本願化合物とは化学構造を異にする。さらに、米国特許5157039号公報及び5288743号には、ピリジン誘導体が、英国特許2265621号公報には、キノリン誘導体がそれぞれ記載されているが、それらはいずれもアセタミドを部分構造として有することを必須の特徴としており、本願化合物とは化学構造を異にする。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】前記米国特許4193787号及び米国特許4423237号公報に記載の化合物は、後記試験例で示すように、除草活性が十分ではない。

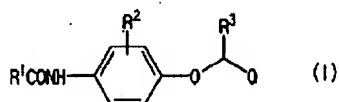
【0005】本発明者は、ヒドロキシアニリン誘導体の合成とその生物活性について永年に亘り鋭意研究を行った結果、既知の化合物とは構造を異にした新規なヒドロキシアニリン誘導体が、水稻に対する薬害をほとんど示さず、しかも水田の強害雑草であるタイヌビエに対し優れた除草活性を示すことを見出し、本発明を完成した。

【0006】

【課題を解決するための手段】本発明は、下記一般式(1)

【0007】

【化2】



【式中、R<sup>1</sup>は、C1～C4アルコキシ基を示し、R<sup>2</sup>は、水素原子、C1～C4アルキル基、C3～C6シクロアルキル基、C1～C4アルコキシ基又はハロゲン原子を示し、R<sup>3</sup>は、水素原子又はC1～C2アルキル基を示し、Qは、下記置換基群から任意に選ばれる1又は2個の置換基により置換されてもよい、少なくとも1個の酸素、硫黄若しくは窒素原子を含み、環原子数が5又は6であり、更にベンゼン環と縮合していてもよい複素環基（但し、オキサゾリル、2-ベンゾオキサゾリル、チアゾリル及び2-ベンゾチアゾリルを除く）を示し、置換基群は、ハロゲン原子、C1～C4アルキル基、C3～C6シクロアルキル基、C1～C4ハロアルキル基、C1～C4アルコキシ基、C3～C6シクロアルコキシ基、C1～C4ハロアルコキシ基、C1～C4アルキルチオ基、C3～C6シクロアルキルチオ基、C1～C4ハロアルキルチオ基、C1～C4アルキルスルホニル基、1又は2個のハロゲン原子により置換されて

もよいフェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、ベンジル基、シアノ基、ニトロ基、C2～C5アルコキシカルボニル基からなる群を示す。】で表されるヒドロキシアニリン誘導体である。

【0008】本明細書において、「C1～C4アルキル基」とは、例えば、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s-ブチル、t-ブチルのような、炭素数1乃至4個の直鎖又は分枝鎖アルキル基であり、好適には、メチル基、エチル基のような炭素数1又は2個のアルキル基であり、更に好適には、メチル基である。

【0009】本明細書において、「C3～C6シクロアルキル基」とは、例えば、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシルのような、炭素数3乃至6個の環状アルキル基であり、好適には、シクロプロピル、シクロブチルのような炭素数3又は4個のシクロアルキル基であり、より好適には、シクロプロピル基である。

【0010】本明細書において、「C1～C4アルコキシ基」とは、例えば、メトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシ、s-ブトキシ、t-ブトキシのような、炭素数1乃至4個の直鎖又は分枝鎖アルコキシ基であり、好適には、例えば、メトキシ、エトキシのような炭素数1又は2個のアルコキシ基であり、更に好適には、メトキシ基である。

【0011】本明細書において、「C3～C6シクロアルコキシ基」とは、例えば、シクロプロポキシ、シクロブトキシ、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシのような、炭素数3乃至6個の環状アルコキシ基であり、好適には、シクロペンチルオキシ、シクロヘキシルオキシのような炭素数5又は6個のシクロアルコキシ基であり、より好適には、シクロヘキシルオキシ基である。

【0012】本明細書において、「C1～C2アルキル基」とは、例えば、メチル又はエチルであり、好適には、メチル基である。

【0013】本明細書において、「ハロゲン原子」とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子であり、好適には、フッ素原子又は塩素原子である。

【0014】本明細書において「C1～C4ハロアルキル基」とは、例えば、クロルメチル、ジクロルメチル、トリクロルメチル、1-クロルエチル、2-クロルエチル、1-クロルプロピル、3-クロルプロピル、1-クロルブチル、4-クロルブチル、フルオロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル、フルオロクロルメチル、ブロモメチル、1-ブロモエチル、2-ブロモエチルのような、同一又は異なった前記「ハロゲン原子」が1乃至5個、前記「C1～C4アルキル基」に結合した基である。好適には、例えば、フル

オロメチル、ジフルオロメチル、トリフルオロメチル、1-フルオロエチル、2-フルオロエチル、1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチルのような、1乃至5個のフッ素原子により置換された炭素数1又は2個のアルキル基であり、更に好適には、トリフルオロメチル基である。

【0015】本明細書において「C1～C4ハロアルコキシ基」とは、例えば、クロロメトキシ、ジクロロメトキシ、トリクロロメトキシ、1-クロロエトキシ、2-クロロエトキシ、1-クロロプロポキシ、3-クロロプロポキシ、1-クロロブトキシ、4-クロロブトキシ、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、1-フルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエトキシ、フルオロクロロメトキシ、プロモメトキシ、1-プロモエトキシ、2-プロモエトキシのような、同一又は異なった前記「ハロゲン原子」が1乃至5個、前記「C1～C4アルコキシ基」に結合した基である。好適には、例えば、フルオロメトキシ、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、1-フルオロエトキシ、2-フルオロエトキシ、1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエトキシのような、1乃至5個のフッ素原子により置換された炭素数1又は2個のアルコキシ基であり、更に好適には、トリフルオロメトキシ基又は1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエトキシ基である。

【0016】本明細書において、「C1～C4アルキルチオ基」とは、例えば、メチルチオ、エチルチオ、プロピルチオ、イソプロピルチオ、ブチルチオ、イソブチルチオ、s-ブチルチオ、t-ブチルチオのような、炭素数1乃至4個の直鎖又は分岐鎖アルキルチオ基である。好適には、炭素数1又は2個のアルキルチオ基であり、更に好適には、メチルチオ基である。

【0017】本明細書において、「C3～C6シクロアルキルチオ基」とは、例えば、シクロプロピルチオ、シクロブチルチオ、シクロペンチルチオ、シクロヘキシルチオのような、炭素数3乃至6個の環状アルキルチオ基であり、好適には、シクロペンチルチオ、シクロヘキシルチオのような炭素数5又は6個のシクロアルキルチオ基であり、より好適には、シクロヘキシルチオ基である。

【0018】本明細書において「C1～C4ハロアルキルチオ基」とは、例えば、クロロメチルチオ、ジクロロメチルチオ、トリクロロメチルチオ、1-クロロエチルチオ、2-クロロエチルチオ、1-クロロプロピルチオ、3-クロロプロピルチオ、1-クロロブチルチオ、4-クロロブチルチオ、フルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、1-フルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチルチオ、フルオロクロロメチルチオ、プロモメチルチオ、1-プロモエチルチオ、2-プロモエチルチオのよ

うな、同一又は異なった前記「ハロゲン原子」が1乃至5個、前記「C1～C4アルキルチオ基」に結合した基である。好適には、例えば、フルオロメチルチオ、ジフルオロメチルチオ、トリフルオロメチルチオ、1-フルオロエチルチオ、2-フルオロエチルチオ、1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチルチオのような、1乃至5個のフッ素原子により置換された炭素数1又は2個のアルキルチオ基であり、更に好適には、トリフルオロメチルチオ基又は1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチルチオ基である。

【0019】本明細書において、「C1～C4アルキルスルホニル基」とは、例えば、メタンスルホニル、エタンスルホニル、プロパンスルホニル、イソプロパンスルホニル、ブタンスルホニル、イソブタンスルホニル、s-ブタンスルホニル、t-ブタンスルホニルのような、炭素数1乃至4個の直鎖又は分岐鎖アルキルスルホニル基である。好適には、炭素数1又は2個のアルキルスルホニル基であり、更に好適には、メタンスルホニル基である。

【0020】本明細書において、「1又は2個のハロゲン原子により置換されてもよいフェニル基」とは、例えば、2-フルオロフェニル、3-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2, 3-ジフルオロフェニル、2, 4-ジフルオロフェニル、2, 5-ジフルオロフェニル、2, 6-ジフルオロフェニル、3, 4-ジフルオロフェニル、3, 5-ジフルオロフェニル、2-クロロフェニル、3-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 3-ジクロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、3, 5-ジクロロフェニル、2-クロロ-4-フルオロフェニル、4-クロロ-2-フルオロフェニルのような、同一又は異なった前記「ハロゲン原子」が1又は2個、フェニル基に結合した基であり、好適には、2-フルオロフェニル、4-フルオロフェニル、2-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、2, 6-ジクロロフェニルのような、1又は2個のフッ素原子もしくは塩素原子により置換されたフェニル基である。

【0021】本明細書において、「C2～C5アルコキシカルボニル基」とは、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニル、プロポキシカルボニル、イソプロポキシカルボニル、ブトキシカルボニル、イソブトキシカルボニル、s-ブトキシカルボニル、t-ブトキシカルボニルのような、炭素数1乃至4個の直鎖又は分岐鎖アルコキシカルボニル基であり、好適には、例えば、メトキシカルボニル、エトキシカルボニルのような炭素数1又は2個のアルコキシカルボニル基である。本明細書において、「少なくとも1個の酸素、硫黄若しくは窒素原子を含み、環原子数が5又は6であり、更にベンゼン環と縮合していてもよい複素環基（但し、オキサゾリル、2

ーベンゾオキサゾリル、チアゾリル及び2-ベンゾチアゾリルを除く)」とは例えば、ピリダジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、チエニル、フラニル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 2, 5-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、インドリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾチオフェニル、2-ベンゾオキサゾリルを除くベンゾオキサゾリル、2-ベンゾチアゾリルを除くベンゾチアゾリル、1, 2, 3-ベンゾトリアゾリル、1, 2, 3-ベンゾチアジアゾリル、キノリル、キノキサリル、キナゾリル、チアゾロ[5, 4-c]ピリジニル、チアゾロ[5, 4-b]ピリジニル、イミダゾロ[1, 2-a]ピリジニル、オキサゾロ[4, 5-b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル、ベンゾジオキサソラニルのような環原子数が5又は6であり更にベンゼン環と縮合してもよい複素環基のうち、オキサゾリル、2-ベンゾオキサゾリル、チアゾリル及び2-ベンゾチアゾリルを除いた複素環基であり、好適には、ピリダジニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、チエニル、フラニル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、1, 2, 3-チアジアゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 2, 5-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、インドリル、ベンゾイソオキサゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾチオフェニル、2-ベンゾオキサゾリルを除くベンゾオキサゾリル、2-ベンゾチアゾリルを除くベンゾチアゾリル、1, 2, 3-ベンゾトリアゾリル、1, 2, 3-ベンゾチアジアゾリル、キノリル、キノキサリル、キナゾリル、チアゾロ[5, 4-c]ピリジニル、チアゾロ[5, 4-b]ピリジニル、イミダゾロ[1, 2-a]ピリジニル、オキサゾロ[4, 5-b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル又はベンゾジオキサソラニルであり、より好適には、ピリジニル、ピラジニル、チエニル、フラニル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、インドリル、ベンゾチオフェニル、2-ベンゾオキサゾリルを除くベンゾオキサゾリル、2-ベンゾチアゾリルを除くベンゾチアゾリル、1, 2, 3-ベンゾトリアゾリル、キノリル、キノキサリル、チアゾロ[5, 4-c]ピリジニル、オキサゾロ[4, 5-b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル又はベンゾジオキサソラニルである。

【0022】本発明の化合物(I)は、例えば、硫酸塩、塩酸塩、硝酸塩、りん酸塩のような塩にすることができる。それら塩は、農園芸用の除草剤として使用でき

るかぎり、本発明に包含される。

【0023】本発明化合物の水和物も、本発明に包含されるものである。

(a) 上記一般式(I)において、 $R^1$ は、好適には、C1~C2アルコキシ基であり、より好適には、メトキシ基である。

(b) 上記一般式(I)において、 $R^2$ は、好適には、水素原子、C1~C4アルキル基又はハロゲン原子であり、より好適には、水素原子又はメチル基である。

(c) 上記一般式(I)において、 $R^3$ は、好適には、水素原子又はメチル基であり、より好適には、水素原子である。

(d) 上記一般式(I)において、Qは、好適には、塩素原子、フッ素原子、メチル基、エチル基、n-ブチル基、シクロプロピル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、メチルチオ基、シクロヘキシルチオ基、メタンスルホニル基、フェニル基、2-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、シアノ基、ニトロ基、メトキシカルボニル基及びエトキシカルボニル基から任意に選ばれる1又は2個の置換基により置換されてもよい、少なくとも1個の酸素、硫黄若しくは窒素原子を含み、環原子数が5又は6であり、更にベンゼン環と縮合していてもよい複素環基(但し、オキサゾリル、2-ベンゾオキサゾリル、チアゾリル及び2-ベンゾチアゾリルを除く。)であり、より好適には、塩素原子、フッ素原子、メチル基、エチル基、n-ブチル基、シクロプロピル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、メチルチオ基、シクロヘキシルチオ基、メタンスルホニル基、フェニル基、2-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、シアノ基、ニトロ基、メトキシカルボニル基及びエトキシカルボニル基からなる群から任意に選ばれる1又は2個の置換基により置換されてもよい、ピリジニル、ピラジニル、チエニル、フラニル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、インドリル、ベンゾチオフェニル、2-ベンゾオキサゾリルを除くベンゾオキサゾリル、2-ベンゾチアゾリルを除くベンゾチアゾリル、1, 2, 3-ベンゾトリアゾリル、キノリル、キノキサリル、チアゾロ[5, 4-c]ピリジニル、オキサゾロ[4, 5-b]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラニル又はベンゾジオキサソラニルであり、更に好適には、2-ピリジニル、3-メチル-2-ピリジニル、4-メチル-2-ピリジニル、5-メチル-2-ピリジニル、4, 6-ジメチル-2-ピリジニル、5-エチル-2-ピリジニル、2-メトキシ-3-ピリジニル、2, 6-ジメトキシ-3-ピリジニル、2-クロロ-3-ピリジニル、6-クロロ-2-ピリジ

ニル、6-クロロ-3-ピリジニル、5-シアノ-2-ピリジニル、5-メトキシカルボニル-2-ピリジニル、5-メチル-2-ピラジニル、2-チエニル、3-チエニル、3-メチル-2-チエニル、4-メチル-2-チエニル、5-メチル-2-チエニル、5-エチル-2-チエニル、4-メトキシ-2-チエニル、5-クロロ-2-チエニル、3-クロロ-4-メチル-2-チエニル、2, 5-ジクロロ-3-チエニル、4, 5-ジクロロ-2-チエニル、4, 5-ジブromo-2-チエニル、5-メチルチオ-2-チエニル、5-シアノ-2-チエニル、5-メトキシカルボニル-2-チエニル、3-フラニル、5-メチル-2-フラニル、3-メチル-5-イソオキサゾリル、5-メチル-3-イソオキサゾリル、3-*tert*-ブチル-5-イソオキサゾリル、3-フェニルイソオキサゾール-5-イル、4, 5-ジクロロ-3-イソチアゾリル、1, 5-ジメチル-3-ピラゾリル、1-フェニル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル、1-フェニル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-5-イル、1-(4-クロロフェニル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル、5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、5-メチルチオ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、5-メタンスルホニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、5-フェニル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル、5-フェニル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、3-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1-メチル-5-インドリル、2-ベンゾチオフェニル、3-メチル-2-ベンゾチオフェニル、5-メチル-2-ベンゾチオフェニル、2-メチル-4-ベンゾオキサゾリル、2-メチル-5-ベンゾオキサゾリル、6-ベンゾオキサゾリル、2-メチル-7-ベンゾオキサゾリル、2-メチル-5-ベンゾチアゾリル、2-エチル-5-ベンゾチアゾリル、6-ベンゾチアゾリル、2-メチル-6-ベンゾチアゾリル、2-シクロプロピル-6-ベンゾチアゾリル、2-トリフルオロメチル-6-ベンゾチアゾリル、1-メチル-1, 2, 3-ベンゾトリアゾール-5-イル、2-キノリル、2-キノキサリル、チアゾロ[5, 4-*c*]ピリジン-6-イル、オキサゾロ[4, 5-*b*]ピリジン-2-イル、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル、2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキサラン-5-イル又は1, 4-ベンゾジオキサラン-6-イルである。

(1) 上記一般式(I)において、好適には、(1a)  $R^1$ は、C1~C2アルコキシ基であり、(1b)  $R^2$ は、水素原子、C1~C4アルキル基又はハロゲン原子であり、(1c)  $R^3$ は、水素原子又はメチル基であ

り、(1d)  $Q$ は、塩素原子、フッ素原子、メチル基、エチル基、*tert*-ブチル基、シクロプロピル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、メチルチオ基、シクロヘキシルチオ基、メタンスルホニル基、フェニル基、2-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、シアノ基、ニトロ基、メトキシカルボニル基及びエトキシカルボニル基から任意に選ばれる1又は2個の置換基により置換されてもよい、少なくとも1個の酸素、硫黄若しくは窒素原子を含み、環原子数が5又は6であり、更にベンゼン環と縮合していてもよい複素環基(但し、オキサゾリル、2-ベンゾオキサゾリル、チアゾリル及び2-ベンゾチアゾリルを除く。)であり

(2) より好適には、(2a)  $R^1$ は、C1~C2アルコキシ基であり、(2b)  $R^2$ は、水素原子、C1~C4アルキル基又はハロゲン原子であり、(2c)  $R^3$ は、水素原子又はメチル基であり、(2d)  $Q$ は、塩素原子、フッ素原子、メチル基、エチル基、*tert*-ブチル基、シクロプロピル基、トリフルオロメチル基、メトキシ基、メチルチオ基、シクロヘキシルチオ基、メタンスルホニル基、フェニル基、2-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、フェノキシ基、フェニルチオ基、シアノ基、ニトロ基、メトキシカルボニル基及びエトキシカルボニル基からなる群から任意に選ばれる1又は2個の置換基により置換されてもよい、ピリジニル、ピラジニル、チエニル、フラニル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、ピラゾリル、1, 2, 4-チアジアゾリル、1, 3, 4-チアジアゾリル、1, 2, 4-オキサジアゾリル、1, 3, 4-オキサジアゾリル、インドリル、ベンゾチオフェニル、2-ベンゾオキサゾリルを除くベンゾオキサゾリル、2-ベンゾチアゾリルを除くベンゾチアゾリル、1, 2, 3-ベンゾトリアゾリル、キノリル、キノキサリル、チアゾロ[5, 4-*c*]ピリジニル、オキサゾロ[4, 5-*b*]ピリジニル、ジヒドロベンゾフラン又はベンゾジオキサソラニルであり、

(3) 更に好適には、(3a)  $R^1$ は、メトキシ基であり、(3b)  $R^2$ は、水素原子又はメチル基であり、

(3c)  $R^3$ は、水素原子であり、(3d)  $Q$ は、2-ピリジニル、3-メチル-2-ピリジニル、4-メチル-2-ピリジニル、5-メチル-2-ピリジニル、4, 6-ジメチル-2-ピリジニル、5-エチル-2-ピリジニル、2-メトキシ-3-ピリジニル、2, 6-ジメトキシ-3-ピリジニル、2-クロロ-3-ピリジニル、6-クロロ-2-ピリジニル、6-クロロ-3-ピリジニル、5-シアノ-2-ピリジニル、5-メトキシカルボニル-2-ピリジニル、5-メチル-2-ピラジニル、2-チエニル、3-チエニル、3-メチル-2-チエニル、4-メチル-2-チエニル、5-メチル-2-チエニル、5-エチル-2-チエニル、4-メトキシ



ー2-チエニル、5-クロロ-2-チエニル、3-クロロ-4-メチル-2-チエニル、2, 5-ジクロロ-3-チエニル、4, 5-ジクロロ-2-チエニル、4, 5-ジブromo-2-チエニル、5-メチルチオ-2-チエニル、5-シアノ-2-チエニル、5-メトキシカルボニル-2-チエニル、3-フラニル、5-メチル-2-フラニル、3-メチル-5-イソオキサゾリル、5-メチル-3-イソオキサゾリル、3-ヒューズチル-5-イソオキサゾリル、3-フェニルイソオキサゾール-5-イル、4, 5-ジクロロ-3-イソチアゾリル、1, 5-ジメチル-3-ピラゾリル、1-フェニル-3-トリフルオロメチルピラゾール-5-イル、1-フェニル-3-(1, 1, 2, 2, 2-ペンタフルオロエチル)ピラゾール-5-イル、1-(4-クロロフェニル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル、5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イル、3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、5-メチルチオ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、5-メタンスルホニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イル、5-フェニル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イル、5-フェニル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イル、3-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イル、1-メチル-5-インドリル、2-ベンゾチオフェニル、3-メチル-2-ベンゾチオフェニル、5-メチル-2-ベンゾチオフェニル、2-メチル-4-ベンゾオキサゾリル、2-メチル-5-ベンゾオキサゾリル、6-ベンゾオキサゾリル、2-メチル-7-ベンゾオキサゾリル、2-メチル-5-ベンゾチアゾリル、2-エチル-5-ベンゾチアゾリル、6-ベンゾチアゾリル、2-メチル-6-ベンゾチアゾリル、2-エチル-6-ベンゾチアゾリル、2-シクロプロピル-6-ベンゾチアゾリル、2-トリフルオロメチル-6-ベンゾチアゾリル、1-メチル-1, 2, 3-ベンゾトリアゾール-5-イル、2-キノリル、2-キノキサリル、チアゾロ[5, 4-c]ピリジン-6-イル、オキサゾロ[4, 5-b]ピリジン-2-イル、2, 3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル、2, 2-ジフルオロ-1, 3-ベンゾジオキサラン-5-イル又は1, 4-ベンゾジオキサラン-6-イルであり、

(4) 最も好適には、メチル [4-(5-エチルピリジン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル] カルバマート (化合物番号125)、メチル [2-メチル-4-(5-メチルチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル] カルバマート (化合物番号215)、メチル [2-メチル-4-(3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イルメトキシ)フェニル] カルバマート (化合物番号372)、メチル [2-メチル-4-(3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イルメトキシ)フェニル] カルバマート (化合物番号3

73)、メチル [4-(5-メチルチオ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルメトキシ)フェニル] カルバマート (化合物番号386)、メチル [2-メチル-4-(5-メチルチオ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルメトキシ)フェニル] カルバマート (化合物番号387)、メチル [4-(ベンゾチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル] カルバマート (化合物番号426)、メチル [4-(ベンゾチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル] カルバマート (化合物番号427)、メチル [2-メチル-4-(キノリン-2-イルメトキシ)フェニル] カルバマート (化合物番号492)、メチル [4-(5-シアノピリジン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル] カルバマート (化合物番号155)、メチル [4-(4, 5-ジクロロチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル] カルバマート (化合物番号208)、メチル [2-メチル-4-(4-メチルチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル] カルバマート (化合物番号213)、メチル [4-(5-エチルチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル] カルバマート (化合物番号234)、メチル [2-メチル-4-(5-メチルベンゾチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル] カルバマート (化合物番号431)、メチル [4-(2-エチルベンゾチアゾール-6-イルメトキシ)-2-メチルフェニル] カルバマート (化合物番号472) 又はメチル [2-メチル-4-(2-トリフルオロメチルベンゾチアゾール-6-イルメトキシ)フェニル] カルバマート (化合物番号475) である。

【0024】本発明の代表化合物を下記表1に例示するが、本発明はこれらの化合物に限定されるものではない。

【0025】下記表において、「Me」は、メチル基を、「Et」は、エチル基を、「Pr」は、プロピル基を、「Bu」は、ブチル基を、「Hex」は、ヘキシル基を、「Ph」は、フェニル基を、「Bn」は、ベンジル基を、「Pyrid」は、ピリジン基を、「Py」は、ピリジン基を、「Pyrin」は、ピリミジン基を、「Pyrid」は、ピラジン基を、「The」は、チエニル基を、「Fur」は、フラニル基を、「Isoxa」は、イソオキサゾリル基を、「Isothia」は、イソチアゾリル基を、「Imidaz」は、イミダゾリル基を、「Pyras」は、ピラゾリル基を、「1,2,3-Triaz」は、1, 2, 3-トリアゾリル基を、「1,2,4-Triaz」は、1, 2, 4-トリアゾリル基を、「1,2,3-Thiad」は、1, 2, 3-チアジアゾリル基を、「1,2,4-Thiad」は、1, 2, 4-チアジアゾリル基を、「1,2,5-Thiad」は、1, 2, 5-チアジアゾリル基を、「1,3,4-Thiad」は、1, 3, 4-チアジアゾリル基を、「1,2,4-Oxad」は、1, 2, 4-オキサジアゾリル基を、「Indo」は、インドリル基を、「Bisoxa」は、ベンゾイソオキサゾリル基を、「Bimidaz」は、ベ

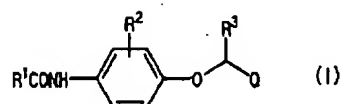


ンゾイミダゾリル基を、「Bthio」は、ベンゾチオフェニル基を、「Boxa」は、ベンゾオキサゾリル基を、「Bthia」は、ベンゾチアゾリル基を、「1,2,3-Btriaz」は、1, 2, 3-ベンゾトリアゾリル基を、「1,2,3-Bthiad」は、1, 2, 3-ベンゾチアジアゾリル基を、「Quino」は、キノリル基を、「Quinox」は、キノキサリル基を、「Quinaz」は、キナゾリル基を、「Thia[c]py」は、チアゾロ[5, 4-c]ピリジニル基を、「Thia[c]py」は、チアゾロ[5, 4-b]ピリジニル基を、「Imidaz[a]py」は、イミダゾ[1, 2-a]ピリジニル基を、「Oxa[b]py」は、オキサゾロ[4, 5-b]ピリジニル基を、「Dihydrobfur」は、ジヒドロベンゾフラニル

基を、「Bdioxo」は、ベンゾジオキソラニル基を、「i」は、イソを、「c」は、シクロを、「s」は、セカンダリーを、「t」は、ターシャリーを、それぞれ示す。

【0026】

【化3】



【0027】

【表1】

化合物番号	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Q
1	MeO	H	H	3-Pyrid
2	MeO	2-Me	H	3-Pyrid
3	MeO	2-Me	Me	3-Pyrid
4	MeO	2-Me	H	6-Cl-3-Pyrid
5	MeO	2-Et	H	6-Cl-3-Pyrid
6	MeO	2-Pr	H	6-Cl-3-Pyrid
7	MeO	2-iPro	H	6-Cl-3-Pyrid
8	MeO	2-tBu	H	6-Cl-3-Pyrid
9	EtO	H	H	3-Pyrid
10	EtO	2-Me	H	6-Me-3-Pyrid
11	MeO	H	H	2-Py
12	MeO	2-Me	H	2-Py
13	MeO	2-Me	Me	2-Py
14	MeO	H	H	3-Py
15	MeO	2-Me	H	3-Py
16	MeO	2-Me	Me	3-Py
17	MeO	H	H	4-Py
18	MeO	2-Me	H	4-Py
19	MeO	2-Me	Me	4-Py
20	MeO	H	H	3-Cl-2-Py
21	MeO	2-Me	H	3-Cl-2-Py
22	MeO	H	H	4-Cl-2-Py
23	MeO	2-Me	H	4-Cl-2-Py
24	MeO	H	H	5-Cl-2-Py
25	MeO	2-Me	H	5-Cl-2-Py
26	MeO	H	H	6-Cl-2-Py
27	MeO	2-Me	H	6-Cl-2-Py
28	MeO	2-Me	Me	6-Cl-2-Py
29	MeO	2-Me	Et	6-Cl-2-Py
30	MeO	2-Et	H	6-Cl-2-Py
31	MeO	2-Pr	H	6-Cl-2-Py
32	MeO	2-iPr	H	6-Cl-2-Py
33	MeO	2-Bu	H	6-Cl-2-Py
34	MeO	2-iBu	H	6-Cl-2-Py
35	MeO	2-sBu	H	6-Cl-2-Py

36	MeO	2-tBu	H	6-Cl-2-Py
37	MeO	2-cPr	H	6-Cl-2-Py
38	MeO	2-cBu	H	6-Cl-2-Py
39	MeO	2-cPen	H	6-Cl-2-Py
40	MeO	2-cHex	H	6-Cl-2-Py
41	MeO	2-MeO	H	6-Cl-2-Py
42	MeO	2-MeO	Me	6-Cl-2-Py
43	MeO	2-MeO	Et	6-Cl-2-Py
44	MeO	2-EtO	H	6-Cl-2-Py
45	MeO	2-PrO	H	6-Cl-2-Py
46	MeO	2-iPrO	H	6-Cl-2-Py
47	MeO	2-BuO	H	6-Cl-2-Py
48	MeO	2-iBuO	H	6-Cl-2-Py
49	MeO	2-sBuO	H	6-Cl-2-Py
50	MeO	2-tBuO	H	6-Cl-2-Py
51	MeO	2-Cl	H	6-Cl-2-Py
52	MeO	2-Cl	Me	6-Cl-2-Py
53	MeO	2-Cl	Et	6-Cl-2-Py
54	MeO	2-F	H	6-Cl-2-Py
55	MeO	2-Br	H	6-Cl-2-Py
56	MeO	2-I	H	6-Cl-2-Py
57	MeO	3-Me	H	6-Cl-2-Py
58	MeO	3-Me	Me	6-Cl-2-Py
59	MeO	3-Me	Et	6-Cl-2-Py
60	MeO	3-Et	H	6-Cl-2-Py
61	MeO	3-Pr	H	6-Cl-2-Py
62	MeO	3-iPr	H	6-Cl-2-Py
63	MeO	3-tBu	H	6-Cl-2-Py
64	MeO	3-cPr	H	6-Cl-2-Py
65	MeO	3-MeO	H	6-Cl-2-Py
66	MeO	3-MeO	Me	6-Cl-2-Py
67	MeO	3-MeO	Et	6-Cl-2-Py
68	MeO	3-EtO	H	6-Cl-2-Py
69	MeO	3-PrO	H	6-Cl-2-Py
70	MeO	3-iPrO	H	6-Cl-2-Py
71	MeO	3-BuO	H	6-Cl-2-Py
72	MeO	3-tBuO	H	6-Cl-2-Py
73	MeO	3-Cl	H	6-Cl-2-Py
74	MeO	3-Cl	Me	6-Cl-2-Py
75	MeO	3-F	H	6-Cl-2-Py
76	MeO	2-Me	H	3-F-2-Py
77	MeO	2-Me	H	4-F-2-Py
78	MeO	2-Me	H	5-F-2-Py
79	MeO	2-Me	H	6-F-2-Py
80	MeO	2-Me	H	4,6-Cl <sub>2</sub> -2-Py
81	MeO	2-Me	H	5,6-Cl <sub>2</sub> -2-Py
82	MeO	2-Me	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -3-Py
83	MeO	2-Me	H	5,6-Cl <sub>2</sub> -3-Py
84	MeO	2-Me	H	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-Py
85	MeO	H	H	3-Me-2-Py

86	MeO	2-Me	H	3-Me-2-Py
87	MeO	H	H	4-Me-2-Py
88	MeO	2-Me	H	4-Me-2-Py
89	MeO	H	H	5-Me-2-Py
90	MeO	2-Me	H	5-Me-2-Py
91	MeO	H	H	6-Me-2-Py
92	MeO	2-Me	H	6-Me-2-Py
93	MeO	2-Me	Me	6-Me-2-Py
94	MeO	2-Me	Et	6-Me-2-Py
95	MeO	2-Et	H	3-Me-2-Py
96	MeO	2-tBu	H	3-Me-2-Py
97	MeO	2-cPr	H	3-Me-2-Py
98	MeO	2-MeO	H	3-Me-2-Py
99	MeO	2-MeO	Me	3-Me-2-Py
100	MeO	2-Cl	H	3-Me-2-Py
101	MeO	2-Cl	Me	3-Me-2-Py
102	MeO	2-Cl	Et	3-Me-2-Py
103	MeO	2-F	H	3-Me-2-Py
104	MeO	2-Br	H	3-Me-2-Py
105	MeO	2-I	H	3-Me-2-Py
106	MeO	3-Me	H	3-Me-2-Py
107	MeO	3-Et	H	3-Me-2-Py
108	MeO	3-Pr	H	3-Me-2-Py
109	MeO	3-iPr	H	3-Me-2-Py
110	MeO	3-tBu	H	3-Me-2-Py
111	MeO	3-cPr	H	3-Me-2-Py
112	MeO	3-MeO	H	3-Me-2-Py
113	MeO	3-EtO	H	3-Me-2-Py
114	MeO	3-iPrO	H	3-Me-2-Py
115	MeO	3-tBuO	H	3-Me-2-Py
116	MeO	3-Cl	H	3-Me-2-Py
117	MeO	3-Cl	Me	3-Me-2-Py
118	MeO	3-F	H	3-Me-2-Py
119	MeO	H	H	4,6-Me <sub>2</sub> -2-Py
120	MeO	2-Me	H	4,6-Me <sub>2</sub> -2-Py
121	MeO	2-Me	H	2-Cl-6-Me-3-Py
122	MeO	2-Me	H	3-Et-2-Py
123	MeO	2-Me	H	4-Et-2-Py
124	MeO	H	H	5-Et-2-Py
125	MeO	2-Me	H	5-Et-2-Py
126	MeO	2-Me	H	6-Et-2-Py
127	MeO	2-Me	H	3-iPr-2-Py
128	MeO	2-Me	H	3-tBu-2-Py
129	MeO	2-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-Py
130	MeO	2-Me	H	5-CF <sub>3</sub> -2-Py
131	MeO	2-Me	H	6-CF <sub>3</sub> -2-Py
132	MeO	2-Me	H	5-OMe-2-Py
133	MeO	2-Me	H	6-MeO-2-Py
134	MeO	2-Me	H	2-MeO-3-Py
135	MeO	2-Me	H	2,6-(MeO) <sub>2</sub> -3-Py

136	MeO	2-Me	H	2-Cl-6-MeO-4-Py
137	MeO	2-Me	H	5-CF <sub>3</sub> O-2-Py
138	MeO	2-Me	H	6-CF <sub>3</sub> O-2-Py
139	MeO	2-Me	H	5-MeS-2-Py
140	MeO	2-Me	H	6-MeS-2-Py
141	MeO	2-Me	H	2-MeS-3-Py
142	MeO	2-Me	H	2-Cl-3-Py
143	MeO	2-Me	H	6-Cl-3-Py
144	MeO	2-Me	H	2-Me-3-Py
145	MeO	2-Me	H	6-Me-3-Py
146	MeO	2-Me	H	2-Cl-4-Py
147	MeO	2-Me	H	6-Cl-4-Py
148	MeO	2-Me	H	2-Me-4-Py
149	MeO	2-Me	H	5-PhO-2-Py
150	MeO	2-Me	H	2-PhO-3-Py
151	MeO	2-Me	H	5-PhS-2-Py
152	MeO	2-Me	H	2-PhS-3-Py
153	MeO	2-Me	H	5-cHexS-2-Py
154	MeO	2-Me	H	2-cHexS-3-Py
155	MeO	2-Me	H	5-CN-2-Py
156	MeO	2-Me	H	5-CO <sub>2</sub> Me-2-Py
157	MeO	H	H	2-Pyrim
158	MeO	2-Me	H	2-Pyrim
159	MeO	2-Me	H	4,6-Me <sub>2</sub> -2-Pyrim
160	MeO	2-Me	H	5-Me-2-Pyrim
161	MeO	2-Me	H	5-CN-2-Pyrim
162	MeO	2-Me	H	4,6-(MeO) <sub>2</sub> -2-Pyrim
163	MeO	2-Me	H	4-Pyrim
164	MeO	2-Me	H	2-Cl-4-Pyrim
165	MeO	2-Me	H	2-Pyrad
166	MeO	2-Me	Me	2-Pyrad
167	MeO	2-Me	H	3-Cl-2-Pyrad
168	MeO	2-Me	H	6-Cl-2-Pyrad
169	MeO	2-Me	H	5-Me-2-Pyrad
170	MeO	2-Me	H	5-CN-2-Pyrad
171	MeO	H	H	2-Thie
172	MeO	2-Me	H	2-Thie
173	MeO	H	Me	2-Thie
174	MeO	2-Me	Me	2-Thie
175	MeO	H	H	3-Thie
176	MeO	2-Me	H	3-Thie
177	MeO	2-Me	Me	3-Thie
178	MeO	H	H	3-Cl-2-Thie
179	MeO	2-Me	H	3-Cl-2-Thie
180	MeO	2-Me	H	4-Cl-2-Thie
181	MeO	H	H	5-Cl-2-Thie
182	MeO	2-Me	H	5-Cl-2-Thie
183	MeO	H	Me	5-Cl-2-Thie
184	MeO	2-Me	Me	5-Cl-2-Thie
185	MeO	2-Me	Et	5-Cl-2-Thie

186	MeO	2-Et	H	5-Cl-2-Thie
187	MeO	2-Pr	H	5-Cl-2-Thie
188	MeO	2-iPr	H	5-Cl-2-Thie
189	MeO	2-Bu	H	5-Cl-2-Thie
190	MeO	2-iBu	H	5-Cl-2-Thie
191	MeO	2-sBu	H	5-Cl-2-Thie
192	MeO	2-tBu	H	5-Cl-2-Thie
193	MeO	2-cPr	H	5-Cl-2-Thie
194	MeO	2-MeO	H	5-Cl-2-Thie
195	MeO	2-MeO	Me	5-Cl-2-Thie
196	MeO	2-MeO	Et	5-Cl-2-Thie
197	MeO	2-Cl	Me	5-Cl-2-Thie
198	MeO	2-F	H	5-Cl-2-Thie
199	MeO	3-Me	Me	5-Cl-2-Thie
200	MeO	3-Cl	H	5-Cl-2-Thie
201	MeO	3-Cl	Me	5-Cl-2-Thie
202	MeO	3-F	H	5-Cl-2-Thie
203	MeO	2-Me	H	3-F-2-Thie
204	MeO	2-Me	H	4-F-2-Thie
205	MeO	2-Me	H	5-F-2-Thie
206	MeO	2-Me	H	5-F-2-Thie
207	MeO	2-Me	H	3,5-Cl <sub>2</sub> -2-Thie
208	MeO	2-Me	H	4,5-Cl <sub>2</sub> -2-Thie
209	MeO	2-Me	H	4,5-Br <sub>2</sub> -2-Thie
210	MeO	H	H	3-Me-2-Thie
211	MeO	2-Me	H	3-Me-2-Thie
212	MeO	H	H	4-Me-2-Thie
213	MeO	2-Me	H	4-Me-2-Thie
214	MeO	H	H	5-Me-2-Thie
215	MeO	2-Me	H	5-Me-2-Thie
216	MeO	2-Et	H	3-Me-2-Thie
217	MeO	2-tBu	H	3-Me-2-Thie
218	MeO	2-cPr	H	3-Me-2-Thie
219	MeO	2-MeO	H	3-Me-2-Thie
220	MeO	2-MeO	Me	3-Me-2-Thie
221	MeO	2-Cl	H	3-Me-2-Thie
222	MeO	2-Cl	Me	3-Me-2-Thie
223	MeO	2-Cl	Et	3-Me-2-Thie
224	MeO	2-F	H	3-Me-2-Thie
225	MeO	3-Me	H	3-Me-2-Thie
226	MeO	3-Cl	H	3-Me-2-Thie
227	MeO	3-Cl	Me	3-Me-2-Thie
228	MeO	3-F	H	3-Me-2-Thie
229	MeO	2-Me	H	3,5-Me <sub>2</sub> -2-Thie
230	MeO	H	H	3-Cl-5-Me-2-Thie
231	MeO	2-Me	H	3-Cl-5-Me-2-Thie
232	MeO	2-Me	H	3-Et-2-Thie
233	MeO	2-Me	H	4-Et-2-Thie
234	MeO	2-Me	H	5-Et-2-Thie
235	MeO	2-Me	H	3-iPr-2-Thie

236	MeO	2-Me	H	3-tBu-2-Thie
237	MeO	2-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -2-Thie
238	MeO	2-Me	H	5-CF <sub>3</sub> -2-Thie
239	MeO	2-Me	H	3-MeO-2-Thie
240	MeO	2-Me	H	4-MeO-2-Thie
241	MeO	2-Me	H	5-MeO-2-Thie
242	MeO	2-Me	H	4-MeO-3-Thie
243	MeO	2-Me	H	5-CF <sub>3</sub> O-2-Thie
244	MeO	2-Me	H	3-MeS-2-Thie
245	MeO	H	H	5-MeS-2-Thie
246	MeO	2-Me	H	5-MeS-2-Thie
247	MeO	2-Me	H	2-Cl-3-Thie
248	MeO	2-Me	H	5-Cl-3-Thie
249	MeO	2-Me	H	2-Me-3-Thie
250	MeO	2-Me	H	5-Me-3-Thie
251	MeO	H	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -3-Thie
252	MeO	2-Me	H	2,5-Cl <sub>2</sub> -3-Thie
253	MeO	2-Me	H	2-Cl-5-Me-3-Thie
254	MeO	2-Me	H	2-MeS-3-Thie
255	MeO	2-Me	H	5-CN-2-Thie
256	MeO	2-Me	H	4-CN-5-MeS-2-Thie
257	MeO	2-Me	H	5-CD <sub>2</sub> Me-2-Thie
258	MeO	2-Me	H	5-NO <sub>2</sub> -2-Thie
259	MeO	2-Me	H	5-NO <sub>2</sub> -3-Thie
260	MeO	H	H	2-Fur
261	MeO	2-Me	H	2-Fur
262	MeO	H	H	3-Fur
263	MeO	2-Me	H	3-Fur
264	MeO	2-Me	Me	3-Fur
265	MeO	2-Me	H	3-Cl-2-Fur
266	MeO	2-Me	H	5-Cl-2-Fur
267	MeO	2-Me	H	3-Me-2-Fur
268	MeO	2-Me	H	5-Me-2-Fur
269	MeO	2-Me	H	2,5-Me <sub>2</sub> -3-Fur
270	MeO	2-Me	H	5-tBu-2-Me-3-Fur
271	MeO	2-Me	H	2-Cl-3-Fur
272	MeO	2-Me	H	5-Cl-3-Fur
273	MeO	2-Me	H	2-Me-3-Fur
274	MeO	2-Me	H	5-Me-3-Fur
275	MeO	2-Me	H	5-CD <sub>2</sub> Me-2-Fur
276	MeO	2-Me	H	5-CD <sub>2</sub> Et-2-Fur
277	MeO	H	H	3-Isloxaz
278	MeO	2-Me	H	3-Isloxaz
279	MeO	H	H	4-Isloxaz
280	MeO	2-Me	H	4-Isloxaz
281	MeO	H	H	5-Isloxaz
282	MeO	2-Me	H	5-Isloxaz
283	MeO	2-Me	H	4-Cl-3-Isloxaz
284	MeO	2-Me	H	5-Cl-3-Isloxaz
285	MeO	2-Me	H	4-Me-3-Isloxaz

286	MeO	2-Me	H	5-Me-3-Isoxaz
287	MeO	2-Me	H	5-CF <sub>3</sub> -3-Isoxaz
288	MeO	2-Me	H	5-tBu-3-Isoxaz
289	MeO	2-Me	H	5-Ph-3-Isoxaz
290	MeO	2-Me	H	3-Cl-5-Isoxaz
291	MeO	2-Me	H	4-Cl-5-Isoxaz
292	MeO	H	H	3-Me-5-Isoxaz
293	MeO	2-Me	H	3-Me-5-Isoxaz
294	MeO	H	H	3-tBu-5-Isoxaz
295	MeO	2-Me	H	3-tBu-5-Isoxaz
296	MeO	2-Me	H	3-CF <sub>3</sub> -5-Isoxaz
297	MeO	H	H	3-Ph-5-Isoxaz
298	MeO	2-Me	H	3-Ph-5-Isoxaz
299	MeO	2-Me	H	3-(2-Cl-Ph)-5-Me-4-Isoxaz
300	MeO	2-Me	H	3-(2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph)-5-Me-4-Isoxaz
301	MeO	2-Me	H	3-Isotbia
302	MeO	2-Me	H	4-Isotbia
303	MeO	2-Me	H	5-Isotbia
304	MeO	2-Me	H	5-Me-3-Isotbia
305	MeO	2-Me	H	5-Me-4-Isotbia
306	MeO	2-Me	H	3-Me-4-Isotbia
307	MeO	2-Me	H	3-Me-5-Isotbia
308	MeO	2-Me	H	3-Me-5-Cl-4-Isotbia
309	MeO	2-Me	H	4,5-Cl <sub>2</sub> -3-Isotbia
310	MeO	H	H	1-Me-2-Imidaz
311	MeO	2-Me	H	1-Me-2-Imidaz
312	MeO	2-Me	H	1-Me-4,5-Cl <sub>2</sub> -2-Imidaz
313	MeO	2-Me	H	1-Bn-2-Imidaz
314	MeO	2-Me	H	4,5-Cl <sub>2</sub> -1-Imidaz
315	MeO	H	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -1-Imidaz
316	MeO	2-Me	H	2,4,5-Cl <sub>3</sub> -1-Imidaz
317	MeO	H	H	3-Pyraz
318	MeO	2-Me	H	3-Pyraz
319	MeO	H	H	4-Pyraz
320	MeO	2-Me	H	4-Pyraz
321	MeO	H	H	5-Pyraz
322	MeO	2-Me	H	5-Pyraz
323	MeO	2-Me	H	1,4-Me <sub>2</sub> -3-Pyraz
324	MeO	2-Me	H	1,5-Me <sub>2</sub> -3-Pyraz
325	MeO	2-Me	H	1-Me-4-tBu-3-Pyraz
326	MeO	2-Me	H	1-Me-5-tBu-3-Pyraz
327	MeO	2-Me	H	1-Ph-5-Me-3-Pyraz
328	MeO	2-Me	H	1-Ph-5-tBu-3-Pyraz
329	MeO	2-Me	H	1-Me-5-Pyraz
330	MeO	2-Me	H	1,3-Me <sub>2</sub> -5-Pyraz
331	MeO	2-Me	H	1-Me-3-tBu-5-Pyraz
332	MeO	2-Me	H	1-Me-5-CF <sub>3</sub> -4-Pyraz
333	MeO	2-Me	H	1-Et-3-Me-5-Pyraz
334	MeO	2-Me	H	1-tBu-3-Me-5-Pyraz
335	MeO	2-Me	H	1-Ph-3-Me-5-Pyraz



336	MeO	2-Me	H	1-Ph-3-tBu-5-Pyraz
337	MeO	2-Me	H	1-Ph-3-CF <sub>3</sub> -5-Pyraz
338	MeO	2-Me	H	1-Ph-3-CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> -5-Pyraz
339	MeO	2-Me	H	1-Bn-3-tBu-5-Pyraz
340	MeO	2-Me	H	1-(4-Cl-Ph)-5-CF <sub>3</sub> -4-Pyraz
341	MeO	2-Me	H	1-Me-1,2,3-Triaz-4-yl
342	MeO	2-Me	H	1-tBu-1,2,3-Triaz-4-yl
343	MeO	2-Me	H	1-(4-Cl-Ph)-1,2,3-Triaz-4-yl
344	MeO	2-Me	H	1-Me-1,2,3-Triaz-5-yl
345	MeO	2-Me	H	1-tBu-1,2,3-Triaz-5-yl
346	MeO	2-Me	H	1-(4-Cl-Ph)-1,2,3-Triaz-5-yl
347	MeO	H	H	1,2,4-Triaz-3-yl
348	MeO	2-Me	H	1,2,4-Triaz-3-yl
349	MeO	H	H	5-Me-1,2,4-Triaz-3-yl
350	MeO	2-Me	H	5-tBu-1,2,4-Triaz-3-yl
351	MeO	H	H	1,2,3-Thiad-4-yl
352	MeO	H	H	1,2,3-Thiad-5-yl
353	MeO	H	H	4-Me-1,2,3-Thiad-5-yl
354	MeO	H	H	4-MeS-1,2,3-Thiad-5-yl
355	MeO	H	H	4-MeSO <sub>2</sub> -1,2,3-Thiad-5-yl
356	MeO	H	H	5-Me-1,2,3-Thiad-4-yl
357	MeO	H	H	5-MeS-1,2,3-Thiad-4-yl
358	MeO	H	H	5-MeSO <sub>2</sub> -1,2,3-Thiad-4-yl
359	MeO	H	H	1,2,4-Thiad-3-yl
360	MeO	2-Me	H	1,2,4-Thiad-3-yl
361	MeO	H	H	1,2,4-Thiad-5-yl
362	MeO	2-Me	H	1,2,4-Thiad-5-yl
363	MeO	H	H	5-Cl-1,2,4-Thiad-3-yl
364	MeO	2-Me	H	5-Cl-1,2,4-Thiad-3-yl
365	MeO	2-Me	H	5-Me-1,2,4-Thiad-3-yl
366	MeO	2-Me	H	5-MeS-1,2,4-Thiad-3-yl
367	MeO	2-Me	H	5-MeSO <sub>2</sub> -1,2,4-Thiad-3-yl
368	MeO	2-Me	H	5-tBu-1,2,4-Thiad-3-yl
369	MeO	H	H	3-Cl-1,2,4-Thiad-5-yl
370	MeO	2-Me	H	3-Cl-1,2,4-Thiad-5-yl
371	MeO	H	H	3-Me-1,2,4-Thiad-5-yl
372	MeO	2-Me	H	3-Me-1,2,4-Thiad-5-yl
373	MeO	2-Me	H	3-MeS-1,2,4-Thiad-5-yl
374	MeO	2-Me	H	3-MeSO <sub>2</sub> -1,2,4-Thiad-5-yl
375	MeO	2-Me	H	3-tBu-1,2,4-Thiad-5-yl
376	MeO	H	H	3-Ph-1,2,4-Thiad-5-yl
377	MeO	2-Me	H	3-Ph-1,2,4-Thiad-5-yl
378	MeO	H	H	1,2,5-Thiad-3-yl
379	MeO	2-Me	H	1,2,5-Thiad-3-yl
380	MeO	H	H	1,3,4-Thiad-2-yl
381	MeO	2-Me	H	1,3,4-Thiad-2-yl
382	MeO	H	H	1,3,4-Thiad-5-yl
383	MeO	2-Me	H	1,3,4-Thiad-5-yl
384	MeO	2-Me	H	5-Cl-1,3,4-Thiad-2-yl
385	MeO	2-Me	H	5-Me-1,3,4-Thiad-2-yl

386	MeO	H	H	5-MeS-1,3,4-Thiad-2-yl
387	MeO	2-Me	H	5-MeS-1,3,4-Thiad-2-yl
388	MeO	H	H	5-MeSO <sub>2</sub> -1,3,4-Thiad-2-yl
389	MeO	2-Me	H	5-MeSO <sub>2</sub> -1,3,4-Thiad-2-yl
390	MeO	2-Me	H	5-tBu-1,3,4-Thiad-2-yl
391	MeO	2-Me	H	2-Cl-1,3,4-Thiad-5-yl
392	MeO	2-Me	H	2-Me-1,3,4-Thiad-5-yl
393	MeO	2-Me	H	2-MeS-1,3,4-Thiad-5-yl
394	MeO	2-Me	H	2-MeSO <sub>2</sub> -1,3,4-Thiad-5-yl
395	MeO	2-Me	H	2-tBu-1,3,4-Thiad-5-yl
396	MeO	H	H	5-Cl-1,3,4-Oxiad-2-yl
397	MeO	2-Me	H	5-Cl-1,3,4-Oxiad-2-yl
398	MeO	H	H	5-Me-1,3,4-Oxiad-2-yl
399	MeO	2-Me	H	5-Me-1,3,4-Oxiad-2-yl
400	MeO	H	H	5-CF <sub>3</sub> -1,3,4-Oxiad-2-yl
401	MeO	2-Me	H	5-CF <sub>3</sub> -1,3,4-Oxiad-2-yl
402	MeO	2-Me	H	5-tBu-1,3,4-Oxiad-2-yl
403	MeO	2-Me	H	5-Ph-1,3,4-Oxiad-2-yl
404	MeO	H	H	5-Cl-1,2,4-Oxiad-3-yl
405	MeO	2-Me	H	5-Cl-1,2,4-Oxiad-3-yl
406	MeO	H	H	5-Me-1,2,4-Oxiad-3-yl
407	MeO	2-Me	H	5-Me-1,2,4-Oxiad-3-yl
408	MeO	H	H	5-CF <sub>3</sub> -1,2,4-Oxiad-3-yl
409	MeO	2-Me	H	5-CF <sub>3</sub> -1,2,4-Oxiad-3-yl
410	MeO	2-Me	H	5-tBu-1,2,4-Oxiad-3-yl
411	MeO	H	H	5-Ph-1,2,4-Oxiad-3-yl
412	MeO	2-Me	H	5-Ph-1,2,4-Oxiad-3-yl
413	MeO	2-Me	H	1-Me-2-Indo
414	MeO	2-Me	H	1-Me-5-Indo
415	MeO	2-Me	H	1,5-Me <sub>2</sub> -2-Indo
416	MeO	2-Me	H	5-Cl-1-Me-2-Indo
417	MeO	2-Me	H	5-F-1-Me-2-Indo
418	MeO	2-Me	H	3-Bisoxa
419	MeO	2-Me	H	5-Me-3-Bisoxa
420	MeO	2-Me	H	5-Cl-3-Bisoxa
421	MeO	H	H	1-Me-2-Bimidaz
422	MeO	2-Me	H	1-Me-2-Bimidaz
423	MeO	2-Me	H	1-Me-5-Bimidaz
424	MeO	2-Me	H	1,5-Me <sub>2</sub> -2-Bimidaz
425	MeO	2-Me	H	1-Me-5-Cl-2-Bimidaz
426	MeO	H	H	2-Bthio
427	MeO	2-Me	H	2-Bthio
428	MeO	H	H	3-Bthio
429	MeO	2-Me	H	3-Bthio
430	MeO	2-Me	H	3-Me-2-Bthio
431	MeO	2-Me	H	5-Me-2-Bthio
432	MeO	2-Me	H	3-Cl-2-Bthio
433	MeO	2-Me	H	5-Cl-2-Bthio
434	MeO	2-Me	H	3-Cl-3-Bthio
435	MeO	2-Me	H	3-MeO-2-Bthio

436	MeO	2-Me	H	2-Me-3-Bthio
437	MeO	2-Me	H	2-Cl-3-Bthio
438	MeO	2-Me	H	2-MeO-3-Bthio
439	MeO	2-Me	H	4-Boxa
440	MeO	2-Me	H	5-Boxa
441	MeO	2-Me	H	6-Boxa
442	MeO	2-Me	H	7-Boxa
443	MeO	2-Me	H	2-Me-4-Boxa
444	MeO	2-Me	H	2-Et-4-Boxa
445	MeO	2-Me	H	2-cPr-4-Boxa
446	MeO	2-Me	H	2-CF <sub>3</sub> -4-Boxa
447	MeO	2-Me	H	2-Me-5-Boxa
448	MeO	2-Me	H	2-Et-5-Boxa
449	MeO	2-Me	H	2-cPr-5-Boxa
450	MeO	2-Me	H	2-CF <sub>3</sub> -5-Boxa
451	MeO	2-Me	H	2-Me-6-Boxa
452	MeO	2-Me	H	2-Et-6-Boxa
453	MeO	2-Me	H	2-cPr-6-Boxa
454	MeO	2-Me	H	2-CF <sub>3</sub> -6-Boxa
455	MeO	2-Me	H	2-Me-7-Boxa
456	MeO	2-Me	H	2-Et-7-Boxa
457	MeO	2-Me	H	2-cPr-7-Boxa
458	MeO	2-Me	H	2-CF <sub>3</sub> -7-Boxa
459	MeO	2-Me	H	4-Bthia
460	MeO	2-Me	H	5-Bthia
461	MeO	2-Me	H	6-Bthia
462	MeO	2-Me	H	7-Bthia
463	MeO	2-Me	H	2-Me-4-Bthia
464	MeO	2-Me	H	2-Et-4-Bthia
465	MeO	2-Me	H	2-cPr-4-Bthia
466	MeO	2-Me	H	2-CF <sub>3</sub> -4-Bthia
467	MeO	2-Me	H	2-Me-5-Bthia
468	MeO	2-Me	H	2-Et-5-Bthia
469	MeO	2-Me	H	2-cPr-5-Bthia
470	MeO	2-Me	H	2-CF <sub>3</sub> -5-Bthia
471	MeO	2-Me	H	2-Me-6-Bthia
472	MeO	2-Me	H	2-Et-6-Bthia
473	MeO	2-Me	H	2-tBu-6-Bthia
474	MeO	2-Me	H	2-cPr-6-Bthia
475	MeO	2-Me	H	2-CF <sub>3</sub> -6-Bthia
476	MeO	2-Me	H	2-(4-Cl-Ph)-6-Bthia
477	MeO	2-Me	H	2-Me-7-Bthia
478	MeO	2-Me	H	2-Et-7-Bthia
479	MeO	2-Me	H	2-cPr-7-Bthia
480	MeO	2-Me	H	2-CF <sub>3</sub> -7-Bthia
481	MeO	2-Me	H	1-Me-1,2,3-Btriaz-5-yl
482	MeO	2-Me	H	1-Et-1,2,3-Btriaz-5-yl
483	MeO	2-Me	H	2-Me-1,2,3-Btriaz-5-yl
484	MeO	2-Me	H	2-Et-1,2,3-Btriaz-5-yl
485	MeO	2-Me	H	1-Me-1,2,3-Btriaz-6-yl

486	MeO	2-Me	H	1-Et-1,2,3-Btriaz-6-yl
487	MeO	2-Me	H	1,2,3-Bthiad-4-yl
488	MeO	2-Me	H	1,2,3-Bthiad-5-yl
489	MeO	2-Me	H	1,2,3-Bthiad-6-yl
490	MeO	2-Me	H	1,2,3-Bthiad-7-yl
491	MeO	H	H	2-Quino
492	MeO	2-Me	H	2-Quino
493	MeO	2-Me	H	3-Quino
494	MeO	2-Me	H	6-Quino
495	MeO	2-Me	H	8-Quino
496	MeO	2-Me	H	6-Me-2-Quino
497	MeO	2-Me	H	6-F-2-Quino
498	MeO	2-Me	H	4-Cl-2-CF <sub>3</sub> -6-Quino
499	MeO	2-Me	H	4-MeO-2-Quino
500	MeO	H	H	2-Quinox
501	MeO	2-Me	H	2-Quinox
502	MeO	2-Me	H	6-Me-2-Quinox
503	MeO	2-Me	H	6-F-2-Quinox
504	MeO	H	H	2-Quinaz
505	MeO	2-Me	H	2-Quinaz
506	MeO	2-Me	H	6-Me-2-Quinaz
507	MeO	2-Me	H	6-F-2-Quinaz
508	MeO	H	H	Thiaz(b)py-2-yl
509	MeO	2-Me	H	Thiaz(b)py-2-yl
510	MeO	H	H	Thiaz(c)py-2-yl
511	MeO	2-Me	H	Thiaz(c)py-2-yl
512	MeO	2-Me	H	Imidaz(a)py-2-yl
513	MeO	2-Me	H	Imidaz(a)py-3-yl
514	MeO	2-Me	H	3-CD <sub>2</sub> Me-Imidaz(a)py-3-yl
515	MeO	2-Me	H	3-CD <sub>2</sub> Et-Imidaz(a)py-3-yl
516	MeO	2-Me	H	Oxa(a)py-2-yl
517	MeO	2-Me	H	5-Me-Oxa(a)py-2-yl
518	MeO	2-Me	H	5-Cl-Oxa(a)py-2-yl
519	MeO	2-Me	H	5-F-Oxa(a)py-2-yl
520	MeO	2-Me	H	2-Dihydrobfur
521	MeO	2-Me	H	5-Dihydrobfur
522	MeO	2-Me	H	5-Me-2-Dihydrobfur
523	MeO	2-Me	H	5-F-2-Dihydrobfur
524	MeO	2-Me	H	5-Bdioxo
525	MeO	2-Me	H	6-Me-5-Bdioxo
526	MeO	2-Me	H	2,2-F <sub>2</sub> -5-Bdioxo

上記の例示化合物中、好適なものとしては、13、26、27、89、90、124、125、130、135、155、182、184、208、209、211、213、214、215、234、240、246、255、286、293、309、324、371、372、373、386、387、412、426、427、431、443、447、455、461、467、471、472、474、475、48

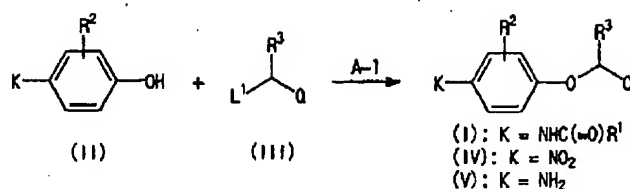
1、491、492、511、516、521番の化合物を挙げることができ、より好適なものとしては、90、125、155、208、213、215、234、293、372、373、386、387、426、427、431、472、475、492番の化合物を挙げることができる。

【0028】

【発明の実施の形態】化合物(1)は、以下に記載する

工程の方法によって製造することができる。

(工程A)



上記工程中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びQは、前記と同意義を示し、Kは工程中に記載された基を示し、Lは、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子のようなハロゲン原子；メタンスルホニルオキシ基のようなアルキルスルホニルオキシ基；又はp-トルエンスルホニルオキシ基のようなアリールスルホニルオキシ基を示す。

#### A-1工程

工程Aは、出発物質である式(II)で表される化合物において、(i) Kが、式NHC(=O)R<sup>1</sup>である場合には、化合物(I)を提供する反応であり、(ii) Kが、ニトロ基又はアミノ基である場合には、化合物(I)を製造する際の出発物質となる式(IV)又は(V)で表される化合物を提供する反応である。

【0030】A-1工程は、フェノール化合物(II)と化合物(III)とを縮合させる工程である。

【0031】本工程は、溶媒の存在下、必要により塩基の存在下で行われる。

【0032】使用される塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウムのようなアルカリ金属炭酸塩；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムt-ブトキシドのような金属アルコキシド；水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物；トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンのような脂肪族三級アミン類；1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセ-7-エン(DBU)のような脂肪族環状三級アミン類；ピリジン、コリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジンのようなピリジン類；n-ブチルリチウム、s-ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド、ナトリウムビストリメチルシリルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミドのような有機金属塩基類等を挙げることができる。好適には、アルカリ金属炭酸塩、金属アルコキシド又はアルカリ金属水素化物であり、より好適には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸セシウム水酸化ナトリウム又は水素化カリウムである。

【0033】使用される溶媒としては、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はないが、例えば、水；メタノール、エタノール、t-ブタノールのようなアルコール類；アセトン、メチルイ

【0029】

【化4】

ソブチルケトンのようなケトン類；アセトニトリルのようなニトリル類；酢酸エチルのようなエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；トルエンのような芳香族炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドのようなアミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類等、及びこれらの混合溶剤を挙げることができる。好適には、アミド類であり、より好適には、ジメチルホルムアミド又はジメチルアセトアミドである。

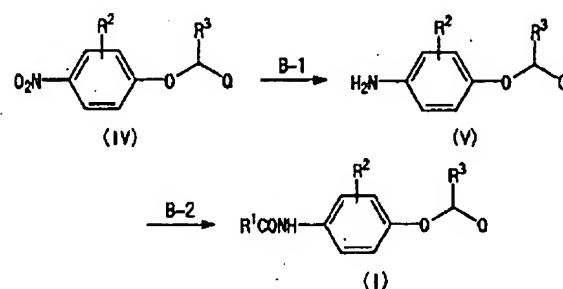
【0034】反応温度は、通常-90℃乃至200℃であり、好適には、0℃乃至100℃である。

【0035】反応時間は、主に反応温度、原料化合物、反応試薬及び使用される溶媒の種類によって異なるが、通常5分乃至24時間であり、好適には、15分乃至6時間である。

(工程B)

【0036】

【化5】



上記工程中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びQは前記と同意義を示す。

#### B-1工程

B-1工程は、上記A-1工程及び下記C-2工程により製造される化合物(IV)のニトロ基を還元し、4-アミノフェノール化合物(V)を得る工程である。

【0037】本工程は、例えばPd-C触媒下水素添加する方法、濃塩酸存在下塩化第一スズを用いる方法、酢酸中亜鉛を用いる方法のような、通常ニトロ基をアミノ基に還元する際の常法に従って行なうことができる。

#### B-2工程

B-2工程は、化合物(V)を、溶媒の存在下又は非存在下、必要に応じて塩基の存在下、一般式R<sup>1</sup>C(=O)L<sup>2</sup>で表わされる化合物[式中、R<sup>1</sup>は前記と同意義

を示し、L<sup>2</sup>は、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を示す。]と反応させ、式(1)の化合物を製造する工程である。

【0038】使用される塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム $\alpha$ -ブトキシドのような金属アルコキシド；水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物；トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンのような脂肪族三級アミン類；N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリンのような三級アニリン類；1,4-ジアザビシクロ

[2.2.2]オクタン(DABCO)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセ-7-エン(DBU)のような脂肪族環状三級アミン類；ピリジン、コリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジンのようなピリジン類； $n$ -ブチルリチウム、 $s$ -ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド、ナトリウムビストリメチルシリルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミドのような有機金属塩基類等を挙げることができる。好適には、アルカリ金属炭酸塩、金属アルコキシド、アルカリ金属水素化物、脂肪族三級アミン類又はピリジン類であり、より好適には、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム $\alpha$ -ブトキシド、

水素化ナトリウム、水素化カリウム、ピリジン、コリジン、又は、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジンである。

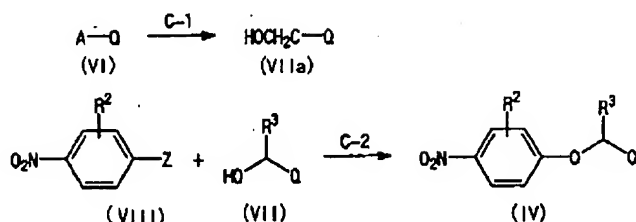
【0039】使用される溶媒としては、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はないが、好適には、水；メタノール、エタノール、 $t$ -ブタノールのようなアルコール類；アセトン、メチルイソブチルケトンのようなケトン類；アセトニトリルのようなニトリル類；酢酸エチルのようなエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；トルエンのような芳香族炭化水素類等、及びこれらの混合溶剤を挙げることができる。好適には、ニトリル類、ハロゲン化炭化水素類又はエーテル類であり、より好適には、塩化メチレン、クロロホルム又はジクロロエタンである。反応温度は、通常-90℃乃至200℃であり、好適には、-10℃乃至100℃である。

【0040】反応時間は、主に反応温度、原料化合物、反応試薬及び使用される溶媒の種類によって異なるが、通常5分乃至24時間であり、好適には、15分乃至6時間である。

(工程C)

【0041】

【化6】



上記式中、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>及びQは、前記と同意義を示し、Aは、ホルミル基、メトキシカルボニル基又はエトキシカルボニル基を示し、Zは、塩素原子、臭素原子又はヨウ素原子を示す。

#### C-1工程

C-1工程は、化合物(VI)のアルデヒドやエステルを還元し、式(VIIa)で表されるアルコール化合物を製造する工程である。

【0042】本工程は、水素化ホウ素ナトリウム、水素化ホウ素リチウムのような還元剤を用いて、通常アルデヒドやエステルを一級アルコールに還元する際の常法に従って行なうことができる。

#### C-2工程

C-2工程は、化合物(VIII)を原料として用いて、化合物(VII)と反応させることにより、化合物(IV)を製造する工程である。

【0043】本工程は、溶媒の存在下、必要により塩基存在下で行われる。

【0044】使用される塩基としては、水酸化ナトリウ

ム、水酸化カリウムのようなアルカリ金属水酸化物；炭酸ナトリウム、炭酸カリウムのようなアルカリ金属炭酸塩；ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム $\alpha$ -ブトキシドのような金属アルコキシド；水素化ナトリウム、水素化カリウムのようなアルカリ金属水素化物；トリエチルアミン、トリブチルアミン、ジイソプロピルエチルアミンのような脂肪族三級アミン類；N,N-ジメチルアニリン、N,N-ジエチルアニリンのような三級アニリン類；1,4-ジアザビシクロ

[2.2.2]オクタン(DABCO)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセ-7-エン(DBU)のような脂肪族環状三級アミン類；ピリジン、コリジン、4-(N,N-ジメチルアミノ)ピリジンのようなピリジン類； $n$ -ブチルリチウム、 $s$ -ブチルリチウム、リチウムジイソプロピルアミド、ナトリウムビストリメチルシリルアミド、リチウムビストリメチルシリルアミドのような有機金属塩基類等を挙げることができる。好適には、金属アルコキシド又はアルカリ金属水素化物であり、より好適には、ナトリウムメトキシ

ド、ナトリウムエトキシド、カリウムセブトキシド、水素化ナトリウム又は水素化カリウムである。

【0045】使用される溶媒としては、反応を阻害せず、出発物質をある程度溶解するものであれば特に限定はないが、好適には、水；アセトン、メチルイソブチルケトンのようなケトン類；アセトニトリルのようなニトリル類；酢酸エチルのようなエステル類；塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタンのようなハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサンのようなエーテル類；トルエンのような芳香族炭化水素類；ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミドのようなアミド類；ジメチルスルホキシドのようなスルホキシド類、及びこれらの混合溶剤を挙げることができる。好適には、アミド類であり、より好適には、ジメチルホルムアミド又はジメチルアセトアミドである。

【0046】反応温度は、通常-90℃乃至200℃であり、好適には、-20℃乃至100℃である。

【0047】反応時間は、主に反応温度、原料化合物、反応試薬及び使用される溶媒の種類によって異なるが、通常5分乃至24時間であり、好適には、15分乃至6時間である。

【0048】上記各反応工程終了後、各工程の目的化合物は常法に従って反応混合物から採取することができる。例えば、反応混合物を適宜中和し、又、不溶物が存在する場合には濾過により除去した後、水と混和しない有機溶媒を加え、水洗後、溶剤を留去することによって得られる。得られた目的化合物は必要ならば、常法、例えば再結晶、再沈殿又はクロマトグラフィー等によって更に精製できる。

【0049】本発明の化合物は、担体及び必要に応じて他の補助剤（界面活性剤等）と混合して、除草剤として通常用いられる製剤形態、例えば粉剤、粗粉剤、粒剤、顆粒剤、水和剤、水溶剤、乳剤、液剤等に調製して使用される。ここでいう担体とは、有効成分化合物の植物への到達性を助け又は有効成分の貯蔵、輸送若しくは取り扱いを容易にするために除草剤中に混合される、合成又は天然の無機又は有機物質を意味する。

【0050】適当な固体担体としては、例えば、カオリナイト群、モンモリロナイト群、アタパルジャイト群等で代表されるクレイ類、タルク、雲母、葉ロウ石、軽石、バーミキュライト、石膏、ドロマイト、けいそう土、マグネシウム石灰、燐石灰、ゼオライト、無水ケイ酸、合成ケイ酸カルシウム、カオリン、ベントナイト、炭酸カルシウム等の無機物質、大豆粉、タバコ粉、クルミ粉、小麦粉、木粉、澱粉、結晶セルロース等の植物性有機物質、クマロン樹脂、石油樹脂、アルキド樹脂、ポリ塩化ビニル、ポリアルキレングリコール、ケトン樹脂、エステルガム、コーパルガム、ダンマルガム等の合成又は天然の高分子化合物、カルナバロウ、パラフィン

ロウ、蜜ロウ等のワックス類或は尿素等を挙げることができる。

【0051】適当な液体担体としては、例えば、ケロシン、鉱油、スピンドル油、ホワイトオイル等のパラフィン系若しくはナフテン系炭化水素、ベンゼン、トルエン、キシレン、エチルベンゼン、クメン、メチルナフタレン等の芳香族炭化水素、四塩化炭素、クロロホルム、トリクロロエチレン、モノクロロベンゼン、クロロトルエン等の塩素化炭化水素、ジオキサン、テトラヒドロフラン等のエーテル類、アセトン、メチルエチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン、アセトフェノン、イソホロン等のケトン類、酢酸エチル、酢酸アミル、エチレングリコールアセテート、ジエチレングリコールアセテート、マレイン酸ジブチル、コハク酸ジエチル等のエステル類、メタノール、ヘキサノール、エチレングリコール、ジエチレングリコール、シクロヘキサノール、ベンジルアルコール等のアルコール類、エチレングリコールエチルエーテル、エチレングリコールフェニルエーテル、ジエチレングリコールエチルエーテル、ジエチレングリコールブチルエーテル等のエーテルアルコール類、ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド等の極性溶媒或は水等を挙げることができる。

【0052】乳化、分散、湿潤、拡張、結合、崩壊性調節、有効成分安定化、流動性改良、防錆、植物への吸収促進等の目的で使用される界面活性剤は、イオン性でも非イオン性でもよい。

【0053】適当な非イオン性界面活性剤としては、例えば、脂肪酸の蔗糖エステル、ラウリルアルコール、ステアリルアルコール、オレイルアルコール等の高級脂肪族アルコールの酸化エチレン重合付加物、イソオクチルフェノール、ノニルフェノール等のアルキルフェノールの酸化エチレン重合付加物、ブチルナフトール、オクチルナフトール等のアルキルナフトールの酸化エチレン重合付加物、パルミチン酸、ステアリン酸、オレイン酸等の高級脂肪酸の酸化エチレン重合付加物、ステアリル燐酸ジラウリル燐酸等のモノ若しくはジアルキル燐酸の酸化エチレン重合付加物、ドデシルアミン、ステアリン酸アミド等の高級脂肪族アミンの酸化エチレン重合付加物、ソルピタン等の多価アルコールの高級脂肪酸エステル及びその酸化エチレン重合付加物並びに酸化エチレンと酸化プロピレンの共重合体等を挙げることができる。

【0054】適当な陰イオン性界面活性剤としては、例えば、ラウリル硫酸ナトリウム、オレイルアルコール硫酸エステルアミン塩等のアルキル硫酸エステル塩、スルホコハク酸ジオクチルエステルナトリウム、オレイン酸ナトリウム、ステアリン酸ナトリウム等の脂肪酸塩類、イソプロピルナフタレンスルホン酸ナトリウム、メチレンビスナフタレンスルホン酸ナトリウム、リグニンスルホン酸ナトリウム、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム等のアルキルアリーールスルホン酸塩等を挙げること



ができる。

【0055】適当な陽イオン性界面活性剤としては、例えば、高級脂肪族アミン、第4級アンモニウム塩類、アルキルピリジニウム塩類等を挙げることができる。

【0056】さらに、本発明の除草剤には、製剤の性状を改善し生物効果を高める目的で、他の成分として、例えば、ゼラチン、アラビアゴム、カゼイン、アルブミン、ニカワ、アルギン酸ソーダ、ポリビニルアルコール、カルボキシメチルセルロース、メチルセルロース、ヒドロキシメチルセルロース等の高分子化合物、ポリリン酸ナトリウム、ベントナイト等のチキソトロピー剤及びその他の補助剤を含有することもある。

【0057】上記の担体及び種々の補助剤は製剤の剤型適用場面を考慮して、目的に応じてそれぞれ単独に或は組み合わされて適宜使用される。

【0058】粉剤は有効成分化合物を通常2乃至10重量部含有し、残部は固体担体である。

【0059】水和剤は有効成分を通常10乃至80重量部含有し、残部は固体担体、分散湿潤剤であって、必要に応じて保護コロイド剤、チキソトロピー剤、消泡剤等が加えられる。

【0060】粒剤は有効成分化合物を通常0.1乃至10重量部含有し、残部は大部分が固体担体である。有効成分化合物は固体担体と均一に混合されているか或は固体担体の表面に均一に固着若しくは吸着されており、粒の径は約0.2乃至1.5mm程度である。

【0061】乳剤は有効成分を通常1乃至50重量部含有しており、これに約5乃至20重量部の乳剤が含まれ、残部は液体担体であり、必要に応じて防錆剤が加えられる。

【0062】このようにして種々の剤型に調製された本発明の化合物を、例えば、水田において雑草の発芽前又は発芽後に土壌処理するときは、10aあたり有効成分として1g乃至1000g好ましくは10g乃至300gを処理することにより、有効に雑草を駆除することができる。

【0063】本発明の除草剤に対して、殺草スペクトラムを広げるために他の除草剤が配合されることは好ましく、場合によっては相乗効果を期待することもできる。

【0064】本発明の除草剤は、もちろん他の植物成長調節剤、殺菌剤、殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤或は肥料等と混合して使用することができる。

【0065】

【実施例】以下に、実施例、製剤例及び試験例を示し、本願発明を具体的に説明するが、本願はこれらに限定されるものではない。

【0066】

【実施例1】メチル [4-(5-クロロチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号182)

(1) 4-(5-クロロチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルアニリン (工程A-1)

2-メチル-4-ヒドロキシアニリン55.4mgをDMF 3mlに溶かし、氷冷下、60%水素化ナトリウム30.0mgを加え、同温度で5分間攪拌した。更に、同温度で、5-クロロ-2-クロロメチルチオフェン0.036mlを加え、室温で3時間攪拌した。反応終了後、反応混合物に、飽和塩化アンモニウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を、水、飽和食塩水で、順に洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。乾燥剤をろ過後、減圧下に溶媒を留去し、得られた粗結晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒 ヘキサン：酢酸エチル=2：1) で精製することにより、標記化合物62.1mg (収率81.6%)を得た。

融点：40℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 6.59-6.86 (5H, m); 5.03 (2H, s), 3.40 (2H, br. s), 2.16 (3H, s).

(2) メチル [4-(5-クロロチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号182) (工程B-2)

上記(1)の方法で製造された4-(5-クロロチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルアニリン62.1mgをジクロロメタン2mlに溶解後、氷水浴中ピリジン0.03ml、クロロ蟻酸メチル0.019mlを加え、さらに4-ジメチルアミノピリジンを触媒量加えた。室温で1時間攪拌した後、反応溶液を水中に静かに加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を、水、飽和食塩水で、順に洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。乾燥剤をろ過後、減圧下に溶媒を留去し、得られた粗結晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒 ヘキサン：酢酸エチル=2：1) で精製することにより、標記化合物70.8mg (収率92.3%)を得た。

融点：85℃

【0067】

【実施例2】メチル [2-メチル-4-(3-メチルベンゾ[b]チオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号430)

(1) 2-ヒドロキシメチル-3-メチルベンゾ[b]チオフェン (工程C-1)

3-メチルベンゾ[b]チオフェン-2-カルバルデヒド0.25gのメタノール溶液15mlに、室温で水素化ホウ素ナトリウム0.54gを加え、さらに2時間攪拌した。反応液を水にあげ、酢酸エチルで抽出した。有機層を、水、飽和食塩水で、順に洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。乾燥剤をろ過後、減圧下に溶媒を留去し、標記化合物0.25g (収率98.9%)を粗生成物として得た。

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.80 (1H, m), 7.67 (1H, m), 7.30-7.46 (2H, m), 5.22 (1H, s).

4.89 (2H, s), 2.37 (3H, s).

(2) 3-メチル-2-(4-ニトロ-3-メチルフェノキシメチル)ベンゾ[b]チオフェン(工程C-2)

上記(1)の方法で得た2-ヒドロキシメチル-3-メチルベンゾ[b]チオフェン0.081gのDMF溶液3mlに、氷冷下、60%水素化ナトリウム0.027gを加え、同温度で5分間攪拌した。その後、同温度で、5-フルオロ-2-ニトロトルエン0.066mlを加え、室温で2時間攪拌した。反応終了後、反応混合物を水に注ぎ、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。乾燥剤をろ過後、減圧下に溶媒を留去し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒 ヘキサン:酢酸エチル=8:2)で精製することにより、標記化合物0.0902g(収率63.3%)を得た。

融点: 123-125℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.09 (1H, d, J=9.9Hz), 7.81-7.87(1H, m), 7.69-7.73 (1H, m), 7.36-7.45 (2H, m), 6.85-6.95 (2H, m), 5.35(3H, s), 2.64 (3H, s), 2.47 (3H, s).

(3) 3-メチル-2-(4-アミノ-3-メチルフェノキシメチル)ベンゾ[b]チオフェン(工程B-1)

上記(2)の方法で製造された3-メチル-2-(4-ニトロ-3-メチルフェノキシメチル)ベンゾ[b]チオフェン0.09gをエタノール8mlに溶解させ、二酸化白金50mgを加えた後、水素雰囲気下室温にて2時間激しく攪拌した。反応溶液にセライトを加えてろ過した後、ろ液を濃縮し、標記化合物0.0814g(収率99.8%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.66-7.88 (2H, m), 7.30-7.46 (2H, m), 6.56-6.81 (3H, m), 5.22 (2H, s), 2.42 (3H, s), 2.17 (3H, s).

(4) メチル [2-メチル-4-(3-メチルベンゾ[b]チオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート(化合物番号430)(工程B-2)

上記(3)の方法で製造された3-メチル-2-(4-アミノ-3-メチルフェノキシメチル)ベンゾ[b]チオフェン0.039gをジクロロメタン2mlに溶解後、氷水浴中ピリジン0.015ml、クロロ蟻酸メチル0.013mlを加え、さらに4-ジメチルアミノピリジンを触媒量加えた。室温で1時間攪拌した後、反応溶液を水中に静かに加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を、水、飽和食塩水で、順に洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。乾燥剤をろ過後、減圧下に溶媒を留去し、得られた粗結晶をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒:ヘキサン:酢酸エチル=2:1)で精製することにより、標記化合物20.2mg(収率42.8%)を得た。

融点: 153-158℃

上記実施例1又は2に準じて、以下の化合物を製造し

た。

【0068】

【実施例3】メチル [2-メチル-4-(ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート(化合物番号13)

融点: 64-66℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.59 (1H, d, J=4.0Hz), 7.75-7.67 (1H, m), 7.52-7.48 (2H, m), 7.26-7.19 (1H, m), 6.83-6.79 (2H, m), 6.26(1H, br.s), 5.17 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0069】

【実施例4】メチル [2-メチル-4-(ピリジン-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート(化合物番号15)

融点: 149-152℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.67 (1H, s), 8.58 (1H, d, J=4.0Hz), 7.79-7.74 (1H, m), 7.50 (1H, br.s), 7.32 (1H, dd, J=7.7, 4.8Hz), 6.82-6.79 (2H, m), 6.25 (1H, br.s), 5.05 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0070】

【実施例5】メチル [2-メチル-4-(ピリジン-4-イルメトキシ)フェニル]カルバマート(化合物番号18)

融点: 112-113℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.58 (2H, d, J=5.6Hz), 7.48 (1H, br.s), 7.32 (2H, d, J=5.6Hz), 6.78-6.74 (2H, m), 6.45 (1H, br.s), 5.04(2H, s), 3.74 (3H, s), 2.21 (3H, s).

【0071】

【実施例6】メチル [4-(6-クロロピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート(化合物番号26)

融点: 130-133℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.72-7.64 (1H, m), 7.45 (1H, dd, J=7.7, 0.8Hz), 7.31-7.24 (3H, m), 6.91 (1H, d, J=9.0Hz), 6.50 (1H, br.s), 5.15 (2H, s), 3.76 (3H, s).

【0072】

【実施例7】メチル [4-(6-クロロピリジン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート(化合物番号27)

融点: 93-94℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.71-7.64 (1H, m), 7.50 (1H, br.s), 7.44 (1H, d, J=7.7Hz), 7.26 (1H, d, J=7.9Hz), 6.81-6.76 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.14 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0073】

【実施例8】メチル [4-(2,6-ジクロロピリジン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート(化合物番号82)

融点: 122-124℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.87 (1H,

d, J=8.1Hz), 7.52 (1H, br.s), 7.30 (1H, d, J=8.1Hz), 6.83-6.71 (2H, m), 6.28 (1H, br.s), 5.06 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0074】

【実施例9】メチル [4-(5,6-ジクロロピリジン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号83)

融点: 110-111°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.35 (1H, d, J=2.1Hz), 7.88 (1H, d, J=2.1Hz), 7.54 (1H, br.s), 6.81-6.77 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.02 (2H, s), 3.79 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0075】

【実施例10】メチル [4-(2,6-ジクロロピリジン-4-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号84)

融点: 138°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.56 (1H, br.s), 7.34 (2H, s), 6.84-6.73 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.03 (2H, s), 3.78 (3H, s), 2.25 (3H, s).

【0076】

【実施例11】メチル [4-(3-メチルピリジン-2-イルメトキシ)-フェニル]カルバマート (化合物番号85)

融点: 115-116°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.44 (1H, d, J=4.8Hz), 7.51 (1H, d, J=7.0Hz), 7.28-7.15 (3H, m), 6.96 (2H, d, J=9.0Hz), 6.66 (1H, br.s), 5.17 (2H, s), 3.74 (3H, s), 2.41 (3H, s).

【0077】

【実施例12】メチル [2-メチル-4-(3-メチルピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号86)

融点: 129-131°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.45 (1H, d, J=4.5Hz), 7.51 (1H, d, J=7.7Hz), 7.45 (1H, br.s), 7.19 (1H, dd, J=7.7, 4.8Hz), 6.89-6.84 (2H, m), 6.24 (1H, br.s), 5.16 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.41 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0078】

【実施例13】メチル [4-(4-メチルピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号87)

融点: 103-108°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.43 (1H, d, J=5.1Hz), 7.32-7.25 (3H, m), 7.04 (1H, d, J=5.1Hz), 6.93 (2H, d, J=9.1Hz), 6.66 (1H, br.s), 5.13 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.35 (3H, s).

【0079】

【実施例14】メチル [2-メチル-4-(4-メチルピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号88)

融点: 72-74°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.42 (1H, d, J=4.9Hz), 7.44 (1H, br.s), 7.31 (1H, s), 7.03 (1H, d, J=5.3Hz), 6.82-6.77 (2H, m), 6.37 (1H, br.s), 5.11 (2H, s), 3.74 (3H, s), 2.35 (3H, s), 2.21 (3H, s).

【0080】

【実施例15】メチル [4-(5-メチルピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号89)

融点: 119-123°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.42 (1H, s), 7.52 (1H, dd, J=7.9, 2.0Hz), 7.39 (1H, d, J=7.9Hz), 7.29-7.24 (2H, m), 6.92 (2H, d, J=9.0Hz), 6.53 (1H, br.s), 5.14 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.34 (3H, s).

【0081】

【実施例16】メチル [2-メチル-4-(5-メチルピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号90)

融点: 120-123°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.41 (1H, s), 7.51 (1H, d, J=7.9Hz), 7.38 (1H, d, J=7.9Hz), 6.82-6.78 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.14 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0082】

【実施例17】メチル [4-(4,6-ジメチルピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号119)

融点: 82-83°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.27 (1H, d, J=9.0Hz), 7.14 (1H, br.s), 6.95-6.90 (3H, m), 6.67 (1H, br.s), 5.10 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.52 (3H, s), 2.31 (3H, s).

【0083】

【実施例18】メチル [4-(4,6-ジメチルピリジン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号120)

物性: アモルファス

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.44 (1H, br.s), 7.13 (1H, s), 6.90 (1H, s), 6.82-6.77 (2H, m), 6.35 (1H, br.s), 5.09 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.52 (3H, s), 2.31 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0084】

【実施例19】メチル [4-(2-クロロ-6-メチルピリジン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号121)

融点: 94-96°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.76 (1H, d, J=7.7Hz), 7.51 (1H, br.s), 7.12 (1H, d, J=7.7Hz), 6.81-6.77 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.08 (2H,

s), 3.76 (3H, s), 2.54 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0085】

【実施例20】メチル [4-(5-エチルピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号124)

融点: 86-89°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.44 (1H, d, J=2.0Hz), 7.54 (1H, dd, J=8.0, 2.0Hz), 7.41 (1H, d, J=8.0Hz), 7.29-7.25 (2H, m), 6.93 (2H, d, J=9.0Hz), 6.49 (1H, br.s), 5.15 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.66 (2H, q, J=7.6Hz), 1.26 (3H, t, J=7.6Hz).

【0086】

【実施例21】メチル [4-(5-エチルピリジン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号125)

融点: 81-85°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.43 (1H, d, J=2.2Hz), 7.54 (1H, dd, J=8.1, 2.2Hz), 7.41 (1H, d, J=8.1Hz), 6.81-6.77 (2H, m), 6.28 (1H, br.s), 5.13 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.66 (2H, q, J=7.6Hz), 2.21 (3H, s), 1.25 (3H, t, J=7.6Hz).

【0087】

【実施例22】メチル [4-(2-メトキシピリジン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号134)

融点: 103°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.12 (1H, dd, J=5.1, 1.9Hz), 7.75-7.71 (1H, m), 7.49 (1H, br.s), 6.94-6.80 (3H, m), 6.18 (1H, br.s), 5.03 (2H, s), 4.00 (3H, s), 3.77 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0088】

【実施例23】メチル [4-(2,6-ジメトキシピリジン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号135)

融点: 131-132°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.60 (1H, d, J=8.0Hz), 7.46 (1H, br.s), 6.82-6.79 (2H, m), 6.31 (1H, d, J=8.0Hz), 6.20 (1H, br.s), 4.95 (2H, s), 3.97 (3H, s), 3.92 (3H, s), 3.76 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0089】

【実施例24】メチル [4-(2-クロロ-6-メトキシピリジン-4-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号136)

融点: 136°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.54 (1H, br.s), 6.96 (1H, d, J=1.0Hz), 6.78-6.70 (3H, m), 6.20 (1H, br.s), 4.98 (2H, s), 3.94 (3H, s), 3.77 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0090】

【実施例25】メチル [2-メチル-4-(2-メチルチオピリ

ジン-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号141)

融点: 89-90°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.41 (1H, dd, J=4.9, 1.7Hz), 7.65 (1H, dd, J=7.5, 1.7Hz), 7.48 (1H, br.s), 7.02 (1H, dd, J=7.5, 4.9Hz), 6.81-6.76 (2H, m), 6.34 (1H, br.s), 4.99 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.62 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0091】

【実施例26】メチル [4-(2-クロロピリジン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号142)

融点: 104-106°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.35 (1H, dd, J=4.8, 1.8Hz), 7.91 (1H, dd, J=7.6, 1.8Hz), 7.52 (1H, br.s), 7.28 (1H, dd, J=7.6, 4.8Hz), 6.83-6.80 (2H, m), 6.26 (1H, br.s), 5.11 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0092】

【実施例27】メチル [4-(6-クロロピリジン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号143)

融点: 162-164°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.44 (1H, d, J=2.4Hz), 7.74 (1H, dd, J=8.2, 2.4Hz), 7.51 (1H, br.s), 7.35 (1H, d, J=8.2Hz), 6.82-6.76 (2H, m), 6.24 (1H, br.s), 5.02 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0093】

【実施例28】メチル [2-メチル-4-(6-メチルピリジン-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号145)

融点: 174-176°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.54 (1H, d, J=2.2Hz), 7.65 (1H, dd, J=8.0Hz, 2.2Hz), 7.49 (1H, br.s), 7.17 (1H, d, J=8.0Hz), 6.83-6.77 (2H, m), 6.25 (1H, br.s), 5.00 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.57 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0094】

【実施例29】メチル [2-メチル-4-(2-メチルピリジン-4-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号148)

融点: 164-166°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.54 (1H, d, J=2.0Hz), 7.65 (1H, dd, J=8.0, 2.0Hz), 7.51 (1H, br.s), 7.18 (1H, d, J=8.0Hz), 6.83-6.77 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.00 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.57 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0095】

【実施例30】メチル [2-メチル-4-(2-フェノキシピリ

ジン-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号150)

融点: 94 - 96°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.10 (1H, dd, J=5.0, 2.0Hz), 7.90 (1H, dd, J=7.4, 2.0Hz), 7.46-7.38 (3H, m), 7.26-7.13 (3H, m), 7.04 (1H, d, J=7.4, 5.0Hz), 6.88-6.85 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.21 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0096】

【実施例31】メチル [2-メチル-4-(2-フェニルチオビリジン-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号152)

融点: 109°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.38 (1H, dd, J=4.8, 1.8Hz), 7.79 (1H, dd, J=7.7, 1.8Hz), 7.52-7.47 (3H, m), 7.41-7.34 (3H, m), 7.13 (1H, d, J=7.7, 4.8Hz), 6.83-6.78 (2H, m), 6.22 (1H, br.s), 5.12 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0097】

【実施例32】メチル [4-(2-シクロヘキシルチオビリジン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号154)

物性: ガム状

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.39 (1H, dd, J=4.9, 1.8Hz), 7.69 (1H, dd, J=7.6, 1.8Hz), 7.50 (1H, br.s), 7.01 (1H, dd, J=7.6, 4.9Hz), 6.82-6.79 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 4.99 (2H, s), 4.13-3.97 (1H, m), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.15-2.04 (2H, m), 1.82-1.27 (8H, m).

【0098】

【実施例33】メチル [4-(5-シアノビリジン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号155)

融点: 132 - 134°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.86 (1H, d, J=1.9Hz), 7.94 (1H, dd, J=8.2, 1.9Hz), 7.68 (1H, d, J=8.2Hz), 7.52 (1H, br.s), 6.81-6.75 (2H, m), 6.28 (1H, br.s), 5.22 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0099】

【実施例34】メチル [4-(5-メトキシカルボニルビリジン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号156)

融点: 131-133°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 9.19 (1H, d, J=2.2Hz), 8.31 (1H, dd, J=8.1, 2.2Hz), 7.61 (1H, d, J=8.1Hz), 7.51 (1H, br.s), 6.82-6.77 (2H, m), 6.27 (1H, br.s), 5.23 (2H, s), 3.96 (3H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0100】

【実施例35】メチル [2-メチル-4-(ピラジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号165)

融点: 110 - 113°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.82 (1H, s), 8.58-8.54 (2H, m), 7.52 (1H, br.s), 6.86-6.81 (2H, m), 6.23 (1H, br.s), 5.21 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0101】

【実施例36】メチル [2-メチル-4-(1-(ピラジン-2-イル)エトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号166)

融点: 54 - 56°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.73 (1H, d, J=1.4Hz), 8.54-8.48 (2H, m), 7.41 (1H, br.s), 6.76-6.67 (2H, m), 6.34 (1H, br.s), 5.43 (1H, q, J=6.5Hz), 3.73 (3H, s), 2.17 (3H, s), 1.69 (3H, d, J=6.5Hz).

【0102】

【実施例37】メチル [2-メチル-4-(5-メチルピラジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号169)

融点: 100 - 102°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.65 (1H, s), 8.43 (1H, s), 7.50 (1H, br.s), 6.83-6.79 (2H, m), 6.29 (1H, br.s), 5.16 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.58 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0103】

【実施例38】メチル [2-メチル-4-(チオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号172)

融点: 109 - 111°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.50 (1H, br.s), 7.32 (1H, dd, J=5.0, 1.3Hz), 7.10 (1H, d, J=3.5Hz), 7.00 (1H, dd, J=5.0, 3.5Hz), 6.85-6.81 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.19 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0104】

【実施例39】メチル [4-(1-(チオフェン-2-イル)エトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号173)

融点: 57 - 60°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.27-7.20 (3H, m), 6.99-6.93 (2H, m), 6.88 (2H, d, J=9.1Hz), 6.50 (1H, br.s), 5.53 (1H, q, J=6.4Hz), 3.75 (3H, s), 1.72 (3H, d, J=6.4Hz).

【0105】

【実施例40】メチル [2-メチル-4-(1-(チオフェン-2-イル)エトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号174)

融点: 60 - 64°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.43 (1H,

br.s), 7.23 (1H, dd, J=5.0, 1.3Hz), 7.00-6.92 (2H, m), 6.79-6.76 (2H, m), 6.17 (1H, br.s), 5.54 (1H, q, J=6.4Hz), 3.75 (3H, s), 2.19 (3H, s), 1.71 (3H, d, J=6.4Hz).

【0106】

【実施例41】メチル [2-メチル-4-(チオフェン-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号176)

融点: 90-92°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.48 (1H, br.s), 7.36-7.31 (2H, m), 7.14 (1H, dd, J=4.7, 1.4 Hz), 6.82-6.79 (2H, m), 6.19 (1H, br.s), 5.04 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0107】

【実施例42】メチル [4-(5-クロロチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号181)

融点: 99-101°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.29 (2H, d, J=9.4Hz), 6.92-6.78 (4H, m), 6.54 (1H, br.s), 5.08 (2H, s), 3.76 (3H, s).

【0108】

【実施例43】メチル [4-(5-クロロチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号182)

融点: 84-85°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.50 (1H, br.s), 6.86-6.77 (4H, m), 6.25 (1H, br.s), 5.07 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0109】

【実施例44】メチル [4-[1-(5-クロロチオフェン-2-イル)エトキシ]フェニル]カルバマート (化合物番号183)

物性: オイル

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.27-7.22 (2H, m), 6.87 (2H, d, J=9.0Hz), 6.73 (2H, s), 6.51 (1H, br.s), 5.39 (1H, q, J=6.4Hz), 3.75 (3H, s), 1.68 (3H, d, J=6.4Hz).

【0110】

【実施例45】メチル [4-[1-(5-クロロチオフェン-2-イル)エトキシ]-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号184)

物性: オイル

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.45 (1H, br.s), 6.79-6.72 (4H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.41 (1H, q, J=6.4Hz), 3.75 (3H, s), 2.20 (3H, s), 1.67 (3H, d, J=6.4Hz).

【0111】

【実施例46】メチル [4-(4,5-ジクロロチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号208)

物番号208)

融点: 129°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.54 (1H, br.s), 6.86 (1H, s), 6.80-6.77 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.05 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0112】

【実施例47】メチル [4-(4,5-ジブromoチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号209)

融点: 120-122°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.52 (1H, br.s), 6.89 (1H, s), 6.81-6.74 (2H, m), 6.24 (1H, br.s), 5.07 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0113】

【実施例48】メチル [4-(3-メチルチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号210)

融点: 45-50°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.31-7.26 (2H, m), 7.22 (1H, d, J=5.1Hz), 6.94 (1H, d, J=9.0 Hz), 6.86 (1H, d, J=5.1Hz), 6.52 (1H, br.s), 5.09 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.26 (3H, s).

【0114】

【実施例49】メチル [2-メチル-4-(3-メチルチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号211)

融点: 90-91°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.50 (1H, br.s), 7.22 (1H, d, J=5.1Hz), 6.88-6.82 (3H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.09 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0115】

【実施例50】メチル [2-メチル-4-(4-メチルチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号213)

融点: 93-97°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.49 (1H, br.s), 6.90-6.80 (3H, m), 6.19 (1H, br.s), 5.11 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0116】

【実施例51】メチル [4-(5-メチルチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号214)

融点: 103-106°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.30-7.26 (2H, m), 6.94-6.87 (3H, m), 6.64-6.62 (1H, m), 6.52 (1H, br.s), 5.10 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.48 (3H, s).

【0117】

【実施例52】メチル [2-メチル-4-(5-メチルチオフ

エン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号215)

融点: 83-84°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.48 (1H, br.s), 6.84-6.80 (3H, m), 6.64 (1H, dd, J=3.4, 1.1 Hz), 6.22 (1H, br.s), 5.09 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.48 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0118】

【実施例53】メチル [4-(3-クロロ-4-メチルチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号230)

融点: 82-87°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.31-7.26 (3H, m), 6.98-6.92 (3H, m), 6.49 (1H, br.s), 5.16 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.21 (3H, d, J=1.0Hz).

【0119】

【実施例54】メチル [4-(3-クロロ-4-メチルチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号231)

融点: 99-102°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.52 (1H, br.s), 6.99 (1H, s), 6.86-6.80 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.15 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s), 2.21 (3H, d, J=1.1Hz).

【0120】

【実施例55】メチル [4-(5-エチルチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号234)

融点: 86-87°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.46 (1H, br.s), 6.89 (1H, d, J=3.5Hz), 6.83-6.77 (2H, m), 6.66 (1H, d, J=3.5Hz), 6.25 (1H, br.s), 5.09 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.82 (2H, q, J=7.5Hz), 2.21 (3H, s), 1.30 (3H, t, J=7.5Hz).

【0121】

【実施例56】メチル [4-(3-メトキシチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号239)

融点: 83-85°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.45 (1H, br.s), 7.26-7.20 (1H, m), 6.87-6.81 (3H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.09 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.75 (3H, s), 2.21 (3H, s).

【0122】

【実施例57】メチル [4-(4-メトキシチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号240)

融点: 87-89°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.47 (1H, br.s), 6.82-6.75 (3H, m), 6.26 (1H, br.s), 6.26 (1

H, br.s), 6.21 (1H, d, J=1.6Hz), 5.06 (2H, d, J=0.7 Hz), 3.78 (3H, s), 3.75 (3H, s), 2.21 (3H, s).

【0123】

【実施例58】メチル [4-(5-メトキシチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号241)

物性: アモルファス

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.49 (1H, br.s), 6.83-6.79 (2H, m), 6.72 (1H, d, J=3.7Hz), 6.21 (1H, br.s), 6.07 (1H, d, J=3.7Hz), 5.01 (2H, s), 3.88 (3H, s), 3.76 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0124】

【実施例59】メチル [4-(4-メトキシチオフェン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号242)

融点: 103-105°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.46 (1H, br.s), 7.24 (1H, d, J=3.3Hz), 6.83-6.79 (2H, m), 6.26-6.24 (2H, m), 4.91 (2H, s), 3.84 (3H, s), 3.76 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0125】

【実施例60】メチル [4-(5-メチルチオチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号245)

融点: 70-71°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.29 (2H, d, J=8.8Hz), 6.96-6.89 (4H, m), 6.54 (1H, br.s), 5.11 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.49 (3H, s).

【0126】

【実施例61】メチル [2-メチル-4-(5-メチルチオチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号246)

融点: 78-79°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.51 (1H, br.s), 6.97-6.92 (2H, m), 6.84-6.80 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.11 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.49 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0127】

【実施例62】メチル [4-(2,5-ジクロロチオフェン-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号251)

融点: 98-99°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.29 (2H, d, J=9.0Hz), 6.89 (1H, s), 6.89 (2H, d, J=9.0Hz), 6.52 (1H, br.s), 4.91 (2H, s), 3.77 (3H, s).

【0128】

【実施例63】メチル [4-(2,5-ジクロロチオフェン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号252)

融点: 151-156°C



<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.51 (1H, br.s), 6.88 (1H, s), 6.79-6.76 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 4.90 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0129】

【実施例64】メチル [4-(5-シアノチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号255)

融点: 132℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.54-7.52 (2H, m), 7.07 (1H, d, J=3.8Hz), 6.81-6.78 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.21 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0130】

【実施例65】メチル [4-(4-シアノ-5-メチルチオチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号256)

物性: アモルファス

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.50 (1H, br.s), 7.10 (1H, s), 6.78-6.73 (2H, m), 6.24 (1H, br.s), 5.07 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.62 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0131】

【実施例66】メチル [4-(5-メトキシカルボニルチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号257)

物性: アモルファス

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.69 (1H, d, J=3.8Hz), 7.50 (1H, br.s), 7.05 (1H, d, J=3.8Hz), 6.82-6.75 (2H, m), 6.25 (1H, br.s), 5.18 (2H, s), 3.87 (3H, s), 3.76 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0132】

【実施例67】メチル [2-メチル-4-(5-ニトロチオフェン-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号259)

融点: 132 - 133℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.95 (1H, d, J=1.7Hz), 7.52 (2H, br.s), 6.79-6.75 (2H, m), 6.23 (2H, m), 4.99 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0133】

【実施例68】メチル [4-(フラン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号261)

融点: 122 - 124℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.47-7.44 (2H, m), 6.85-6.80 (2H, m), 6.42-6.36 (2H, m), 6.23 (1H, br.s), 4.96 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0134】

【実施例69】メチル [4-(フラン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号263)

融点: 84 - 86℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.49-7.26 (3H, m), 6.84-6.77 (2H, m), 6.48 (1H, s), 6.18 (1H, br.s), 4.90 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0135】

【実施例70】メチル [4-(1-(フラン-3-イル)エトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号264)

物性: オイル

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.40-7.32 (2H, m), 6.77-6.71 (2H, m), 6.31-6.21 (3H, m), 5.28 (1H, q, J=6.4Hz), 3.72 (3H, s), 2.16 (3H, s), 1.64 (3H, d, J=6.4Hz).

【0136】

【実施例71】メチル [2-メチル-4-(5-メチルフラン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号268)

融点: 97 - 99℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.49 (1H, br.s), 6.85-6.81 (2H, m), 6.30 (1H, d, J=3.2Hz), 6.19 (1H, br.s), 5.94 (1H, d, J=3.2Hz), 4.89 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.30 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0137】

【実施例72】メチル [4-(2,5-ジメチルフラン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号269)

融点: 112 - 114℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.47 (1H, br.s), 6.82-6.78 (2H, m), 6.23 (1H, br.s), 5.97 (1H, s), 4.74 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.24 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0138】

【実施例73】メチル [4-(5-tert-ブチル-2-メチルフラン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号270)

融点: 58 - 60℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.49 (1H, br.s), 6.83-6.80 (2H, m), 6.23 (1H, br.s), 5.97 (1H, s), 4.74 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.27 (3H, s), 2.24 (3H, s), 1.26 (9H, s).

【0139】

【実施例74】メチル [4-(5-メトキシカルボニルフラン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号275)

融点: 105 - 107℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.46 (1H, br.s), 7.14 (1H, d, J=3.5Hz), 6.77-6.74 (2H, m), 6.49 (1H, d, J=3.5Hz), 6.33 (1H, br.s), 4.99 (2H, s), 3.88 (3H, s), 3.74 (3H, s), 2.20 (3H, s).

## 【0140】

【実施例75】メチル [4-(5-エトキシカルボニルフラン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号276)

融点: 109-111°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.50 (1H, br.s), 7.15 (1H, d, J=3.4Hz), 6.80-6.77 (2H, m), 6.50 (1H, d, J=3.4Hz), 6.29 (1H, br.s), 5.02 (2H, s), 4.37 (2H, q, J=7.1Hz), 3.75 (3H, s), 2.22 (3H, s), 1.38 (3H, t, J=7.1Hz).

## 【0141】

【実施例76】メチル [2-メチル-4-(5-メチルイソオキサゾール-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号286)

物性: ガム状

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.41 (1H, br.s), 6.80-6.73 (2H, m), 6.64 (1H, s), 6.08 (1H, br.s), 5.04 (2H, s), 3.72 (3H, s), 2.39 (3H, d, J=0.8Hz), 2.19 (3H, s).

## 【0142】

【実施例77】メチル [4-(3-メチルイソオキサゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号292)

融点: 138-143°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>+CD<sub>3</sub>OD) δ(ppm): 7.24 (2H, d, J=9.1Hz), 6.80 (2H, d, J=9.1Hz), 6.10 (1H, br.s), 5.00 (2H, s), 3.66 (3H, s), 2.21 (3H, s).

## 【0143】

【実施例78】メチル [2-メチル-4-(3-メチルイソオキサゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号293)

融点: 120-125°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.51 (1H, br.s), 6.80-6.74 (4H, m), 6.27 (1H, br.s), 6.14 (1H, s), 5.08 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.29 (3H, s), 2.22 (3H, s).

## 【0144】

【実施例79】メチル [4-(3-*t*-ブチルイソオキサゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号294)

融点: 71-75°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.31 (2H, d, J=8.9Hz), 6.91 (2H, d, J=8.9Hz), 6.61 (1H, br.s), 6.23 (1H, s), 5.07 (2H, s), 3.76 (3H, s), 1.33 (9H, s).

## 【0145】

【実施例80】メチル [4-(3-*t*-ブチルイソオキサゾール-5-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号295)

融点: 103-108°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.52 (1H, br.s), 6.81-6.78 (2H, m), 6.23 (1H, s), 5.07 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s), 1.33 (9H, s).

## 【0146】

【実施例81】メチル [4-(3-フェニルイソオキサゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号297)

融点: 112-117°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.83-7.78 (2H, m), 7.46-7.42 (3H, m), 7.32 (1H, d, J=9.0Hz), 6.93 (1H, d, J=9.0Hz), 6.67 (1H, br.s), 6.64 (1H, s), 5.17 (2H, s), 3.75 (3H, s).

## 【0147】

【実施例82】メチル [2-メチル-4-(3-フェニルイソオキサゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号298)

融点: 76-80°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.83-7.78 (2H, m), 7.52 (1H, br.s), 7.46-7.43 (3H, m), 6.86-6.81 (2H, m), 6.64 (1H, s), 6.30 (1H, s), 5.16 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

## 【0148】

【実施例83】メチル [4-(3-(2-クロロフェニル)-5-メチルイソオキサゾール-4-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号299)

物性: ガム状

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.51-7.34 (5H, m), 6.65-6.59 (2H, m), 6.16 (1H, br.s), 4.76 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.53 (3H, s), 2.17 (3H, s).

## 【0149】

【実施例84】メチル [4-(3-(2,6-ジクロロフェニル)-5-メチルイソオキサゾール-4-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号300)

物性: ガム状

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.46-7.28 (4H, m), 6.65-6.60 (2H, m), 6.17 (1H, br.s), 4.69 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.54 (3H, s), 2.17 (3H, s).

## 【0150】

【実施例85】メチル [4-(3-メチルイソチアゾール-4-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号306)

融点: 113-114°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.57 (1H, s), 7.31 (2H, d, J=9.0Hz), 6.92 (2H, d, J=9.0Hz), 6.47 (1H, br.s), 5.02 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.52 (3H, s).

## 【0151】

【実施例86】メチル [4-(5-クロロ-3-メチルイソチアゾール-4-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号308)

融点: 120 - 122°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.51 (1H, br.s), 6.86-6.79 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 4.95 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.51 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0152】

【実施例87】メチル [4-(4,5-ジクロロイソチアゾール-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号309)

融点: 99 - 103°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.50 (1H, br.s), 6.86-6.82 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.11 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0153】

【実施例88】メチル [4-(1-ベンジルイミダゾール-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号313)

物性: オイル

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.36-7.26 (4H, m), 7.12-7.05 (3H, m), 6.94-6.92 (1H, m), 6.81-6.73 (2H, m), 6.30 (1H, br.s), 5.22 (2H, s), 5.06 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.20 (3H, s).

【0154】

【実施例89】メチル [4-(1,5-ジメチルピラゾール-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号324)

融点: 148 - 150°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.45 (1H, br.s), 6.85-6.82 (2H, m), 6.18 (1H, br.s), 6.09 (1H, s), 4.96 (2H, s), 3.76 (3H, s), 3.75 (3H, s), 2.25 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0155】

【実施例90】メチル [2-メチル-4-(5-メチル-1-フェニルピラゾール-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号327)

物性: ガム状

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.47-7.40 (6H, m), 6.90-6.86 (2H, m), 6.31 (1H, s), 6.25 (1H, br.s), 5.09 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.34 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0156】

【実施例91】メチル [4-(3-*t*-ブチル-1-メチルピラゾール-5-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号331)

融点: 119 - 121°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.51 (1H, br.s), 6.85-6.79 (2H, m), 6.27 (1H, br.s), 6.15 (1H, s), 4.94 (2H, s), 3.84 (3H, s), 3.76 (3H, s),

2.23 (3H, s), 1.38 (9H, s).

【0157】

【実施例92】メチル [2-メチル-4-(1-メチル-5-トリフルオロメチルピラゾール-4-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号332)

融点: 75 - 78°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.49 (2H, br.s), 6.80-6.77 (2H, m), 6.19 (1H, br.s), 5.01 (2H, s), 3.94 (3H, s), 3.77 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0158】

【実施例93】メチル [4-(1-エチル-3-メチルピラゾール-5-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号333)

融点: 142 - 144°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.52 (1H, br.s), 6.84-6.79 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 6.07 (1H, s), 4.94 (2H, s), 4.12 (2H, q, J=7.2Hz), 3.77 (3H, s), 2.26 (3H, s), 2.24 (3H, s), 1.44 (3H, t, J=7.2Hz).

【0159】

【実施例94】メチル [4-(1-*t*-ブチル-3-メチルピラゾール-5-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号334)

物性: アモルファス

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.50 (1H, br.s), 6.82-6.78 (2H, m), 6.24 (1H, br.s), 6.11 (1H, s), 5.03 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.25 (3H, s), 1.65 (9H, s).

【0160】

【実施例95】メチル [2-メチル-4-(3-メチル-1-フェニルピラゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号335)

融点: 133 - 135°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.57-7.30 (6H, m), 6.78-6.74 (2H, m), 6.34 (1H, s), 6.24 (1H, br.s), 4.92 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.35 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0161】

【実施例96】メチル [2-メチル-4-(1-フェニル-3-トリフルオロメチル-2H-ピラゾール-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号337)

融点: 126 - 130°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.60-7.43 (6H, m), 6.81 (1H, s), 6.76-6.70 (2H, m), 6.25 (1H, br.s), 4.95 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0162】

【実施例97】メチル [2-メチル-4-(5-ペンタフルオロエチル-2-フェニル-2H-ピラゾール-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号338)

融点: 103-107°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.61-7.45 (6H, m), 6.84 (1H, s), 6.74-6.72 (2H, m), 6.29 (1H, br.s), 4.95 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0163】

【実施例98】メチル [4-(1-ペンジール-3-*t*-ブチルピラゾール-5-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号339)

物性: ガム状

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.45 (1H, br.s), 7.28-7.23 (3H, m), 7.07-7.03 (2H, m), 6.69-6.63 (2H, m), 6.26 (1H, br.s), 6.21 (1H, s), 5.37 (2H, s), 4.80 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.20 (3H, s), 1.35 (9H, s).

【0164】

【実施例99】メチル [4-(1-(4-クロロフェニル)-5-トリフルオロメチルピラゾール-4-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号340)

融点: 165-166°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.82 (1H, s), 7.50-7.38 (5H, m), 6.86-6.82 (2H, m), 6.24 (1H, br.s), 5.08 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.25 (3H, s).

【0165】

【実施例100】メチル [4-(1-(4-クロロフェニル)-1,2,3-トリアゾール-4-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号343)

融点: 181°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.01 (1H, s), 7.70 (2H, d, J=9.1Hz), 7.58-7.47 (3H, m), 6.8-6.84 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.27 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0166】

【実施例101】メチル [2-メチル-4-(1,2,3-チアジアゾール-4-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号351)

物性: アモルファス

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.59 (1H, s), 7.52 (1H, br.s), 6.87-6.81 (2H, m), 6.28 (1H, br.s), 5.58 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0167】

【実施例102】メチル [2-メチル-4-(4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号353)

融点: 113-115°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.58 (1H, br.s), 6.82-6.76 (2H, m), 6.27 (1H, br.s), 5.28 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.72 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0168】

【実施例103】メチル [4-(5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号363)

融点: 141-144°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.32-7.27 (2H, m), 6.97 (2H, d, J = 9.1 Hz), 6.46 (1H, br.), 5.26 (2H, s), 3.76 (3H, s).

【0169】

【実施例104】メチル [4-(3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号371)

融点: 183-184°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.33 (2H, d, J = 9.2 Hz), 6.95 (2H, d, J = 9.2 Hz), 6.55 (1H, br.), 5.41 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.70 (3H, s).

【0170】

【実施例105】メチル [2-メチル-4-(3-メチル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号372)

融点: 126-127°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.63-7.52 (1H, m), 6.87-6.79 (2H, m), 6.25 (1H, br.), 5.41 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.70 (3H, s), 2.25 (3H, s).

【0171】

【実施例106】メチル [2-メチル-4-(3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号373)

融点: 134-135°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.65-7.52 (1H, m), 6.86-6.79 (2H, m), 6.24 (1H, br.), 5.39 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.70 (3H, s), 2.25 (3H, s).

【0172】

【実施例107】メチル [4-(3-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号376)

融点: 151-152°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.28-8.33 (2H, m), 7.55-7.64 (1H, m), 7.35 (2H, d, J=9.0Hz), 7.00 (2H, d, J=9.0Hz), 6.51 (1H, br. s), 5.51 (2H, s), 3.78 (3H, s).

【0173】

【実施例108】メチル [2-メチル-4-(3-フェニル-1, 2, 4-チアジアゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号377)

融点: 143-145°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.26-8.33 (2H, m), 7.55-7.64 (1H, m), 7.45-7.55 (3H, m), 6.84-6.91 (2H, m), 6.24 (1H, br. s), 5.51 (2H, s), 3.78 (3H, s), 2.26 (3H, s).

【0174】

【実施例109】メチル [4-(5-メチルチオ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号386)

融点: 128-130°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.33-7.28 (2H, m), 6.96-6.91 (2H, m), 6.51-6.49 (1H, m), 5.40 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.79 (3H, s).

【0175】

【実施例110】メチル [2-メチル-4-(5-メチルチオ-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号387)

融点: 116-118°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.55-7.00 (1H, m), 6.85-6.81 (2H, m), 6.21-6.19 (1H, m), 5.39 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.79 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0176】

【実施例111】メチル [4-(5-メタンスルホニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号388)

融点: 168-169°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.37-7.27 (2H, m), 6.95 (2H, dd, J = 6.8, 2.3 Hz), 5.52 (2H, s), 3.77 (3H, s), 3.48 (3H, s).

【0177】

【実施例112】メチル [2-メチル-4-(5-メタンスルホニル-1, 3, 4-チアジアゾール-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号389)

融点: 130-131°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.60 (1H, br.), 6.84-6.80 (2H, m), 6.26-6.23 (1H, m), 5.52 (2H, s), 3.77 (3H, s), 3.48 (3H, s), 2.25 (3H, s).

【0178】

【実施例113】メチル [2-メチル-4-(5-フェニル-1, 3, 4-オキサジアゾール-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号403)

融点: 110-113°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 8.75 (1H, br.s), 8.06-8.01 (2H, m), 7.68-7.62 (3H, m), 7.23 (1H, d, J=8.5Hz), 6.99-6.91 (2H, m), 5.46 (2H, s), 3.63 (3H, s), 2.18 (3H, s).

【0179】

【実施例114】メチル [4-(5-フェニル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号411)

融点: 113-117°C

【0180】

【実施例115】メチル [2-メチル-4-(5-フェニル-1, 2, 4-オキサジアゾール-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号412)

融点: 132-133°C

【0181】

【実施例116】メチル [2-メチル-4-(1-メチルインドール-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号413)

融点: 144-149°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.61 (1H, dd, J=7.8, 1.0Hz), 7.52 (1H, br.s), 7.36-7.07 (3H, m), 6.90-6.85 (2H, m), 6.58 (1H, s), 6.20 (1H, br.s), 5.16 (2H, s), 3.80 (3H, s), 3.77 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0182】

【実施例117】メチル [2-メチル-4-(1-メチルインドール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号414)

融点: 111-112°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.67 (1H, s), 7.45 (1H, br.s), 7.36-7.30 (2H, m), 7.07 (1H, d, J=3.0Hz), 6.88-6.84 (2H, m), 6.49 (1H, d, J=3.0Hz), 6.19 (1H, br.s), 5.12 (2H, s), 3.80 (3H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0183】

【実施例118】メチル [4-(5-クロロ-1-メチルインドール-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号416)

融点: 164-166°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.56-7.55 (2H, m), 7.24-7.15 (2H, m), 6.89-6.82 (2H, m), 6.52 (1H, s), 6.20 (1H, br.s), 5.13 (2H, s), 3.77 (6H, s), 2.24 (3H, s).

【0184】

【実施例119】メチル [4-(5-フルオロ-1-メチルインドール-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号417)

融点: 162-164°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.52 (1H, br.s), 7.28-7.20 (2H, m), 7.04-6.94 (1H, m), 6.89-6.84 (2H, m), 6.53 (1H, s), 6.29 (1H, br.s), 5.12 (2H, s), 3.77 (3H, s), 3.76 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0185】

【実施例120】メチル [4-(ベンゾイソキサゾール-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号418)

融点: 138-140°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ (ppm): 7.89-7.84 (1H, m), 7.59-7.57 (3H, m), 7.37-7.29 (1H, m), 6.94-6.88 (2H, m), 6.19 (1H, br.s), 5.46 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0186】

【実施例121】メチル [2-メチル-4-(1-メチルベンズ

イミダゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート  
(化合物番号423)

物性: ガム状

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.88-7.78 (2H, m), 7.49-7.30 (3H, m), 6.87-6.82 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.17 (2H, d, J=3.3Hz), 3.85 (3H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0187】

【実施例122】メチル [4-(ベンゾチオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号426)

融点: 155-159°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.84-7.72 (2H, m), 7.39-7.30 (5H, m), 6.97 (2H, d, J = 9.1 Hz), 6.47 (1H, br.), 5.30 (2H, s), 3.77 (3H, s).

【0188】

【実施例123】メチル [4-(ベンゾチオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号427)

融点: 165-168°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.70-7.87 (2H, ?m), 7.26-7.40 (4H, m), 6.81-6.90 (2H, m), 6.20 (1H, br. s), 5.29 (3H, s), 3.77 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0189】

【実施例124】メチル [2-メチル-4-(3-メチルベンゾ[b]チオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号430)

融点: 153-158°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.83-7.79 (1H, m), 7.72-7.68 (1H, m), 7.51 (1H, br.s), 6.87-6.84 (2H, m), 6.22 (1H, br.s), 5.25 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.44 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0190】

【実施例125】メチル [2-メチル-4-(5-メチルベンゾ[b]チオフェン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号431)

融点: 143-145°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.69 (1H, d, J=8.3Hz), 7.54 (1H, s), 7.26-7.13 (2H, m), 6.87-6.84 (2H, m), 6.17 (1H, br.s), 5.27 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.46 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0191】

【実施例126】メチル [4-(3-クロロベンゾ[b]チオフェン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号432)

融点: 133-135°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.84-7.75 (2H, m), 7.53-7.35 (3H, m), 6.89-6.84 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.35 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.22 (3H, s).

H, s).

【0192】

【実施例127】メチル [4-(5-クロロベンゾ[b]チオフェン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号434)

融点: 149-151°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.83 (1H, d, J=1.7Hz), 7.78 (1H, d, J=9.0Hz), 7.53 (2H, br. s), 7.35 (1H, dd, J=8.6, 2.0Hz), 6.90-6.85 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.21 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.25 (3H, s).

【0193】

【実施例128】メチル [4-(ベンゾオキサゾール-6-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号441)

融点: 148-150°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.12 (1H, s), 7.79-7.78 (1H, m), 7.71-7.66 (1H, m), 7.50-7.40 (2H, m), 6.85-6.79 (2H, m), 6.18 (1H, br.s), 5.18 (2H, s), 3.78 (3H, s), 2.25 (3H, s).

【0194】

【実施例129】メチル [2-メチル-4-(2-メチルベンゾオキサゾール-4-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号443)

融点: 116-118°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.47-7.41 (3H, m), 7.32 (1H, d, J=8.1Hz), 6.89-6.84 (2H, m), 6.22 (1H, br.s), 5.42 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.67 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0195】

【実施例130】メチル [2-メチル-4-(2-メチルベンゾオキサゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号447)

融点: 137-138°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.69 (1H, s), 7.47 (1H, d, J=8.4Hz), 7.36 (1H, dd, J=8.4, 1.4Hz), 6.83-6.79 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.12 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.64 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0196】

【実施例131】メチル [2-メチル-4-(2-メチルベンゾオキサゾール-6-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号451)

融点: 164-166°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.63 (1H, d, J=8.2Hz), 7.55 (1H, s), 7.47 (1H, br.s), 7.33 (1H, dd, J=8.2, 1.6Hz), 6.82-6.77 (2H, m), 6.32 (1H, br.s), 5.12 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.63 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0197】

【実施例132】メチル [2-メチル-4-(2-メチルベンゾ

オキサゾール-7-イルメトキシ)フェニル]カルバマート  
(化合物番号455)

融点: 130 - 132°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.61 (1H, dd, J=7.6, 1.4Hz), 7.49 (1H, br.s), 7.40-7.26 (2H, m), 6.88-6.82 (2H, m), 6.32 (1H, br.s), 5.28 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.65 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0198】

【実施例133】メチル [4-(ベンゾチアゾール-6-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート  
(化合物番号461)

融点: 98 - 100°C

<sup>1</sup>H-NMR (270MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.99 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.4Hz), 8.03 (1H, s), 7.55 (1H, dd, J=8.4, 1.5Hz), 7.50 (1H, br.s), 6.84-6.78 (2H, m), 6.27 (1H, br.s), 5.18 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0199】

【実施例134】メチル [2-メチル-4-(2-メチルベンゾチアゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート  
(化合物番号467)

融点: 117°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.97 (1H, s), 7.81 (1H, d, J=8.4Hz), 7.43-7.39 (2H, m), 6.83-6.78 (2H, m), 6.32 (1H, br.s), 5.15 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.83 (3H, s), 2.21 (3H, s).

【0200】

【実施例135】メチル [4-(2-エチルベンゾチアゾール-5-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート  
(化合物番号468)

融点: 128°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.01 (1H, s), 7.84 (1H, d, J=8.1Hz), 7.45-7.40 (2H, m), 6.84-6.81 (2H, m), 6.18 (1H, br.s), 5.17 (2H, s), 3.76 (3H, s), 3.16 (2H, q, J=7.6Hz), 2.23 (3H, s), 1.48 (3H, t, J=7.6Hz).

【0201】

【実施例136】メチル [2-メチル-4-(2-メチルベンゾチアゾール-6-イルメトキシ)フェニル]カルバマート  
(化合物番号471)

融点: 123 - 125°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.94 (1H, d, J=8.4Hz), 7.89 (1H, s), 7.47 (1H, dd, J=8.4, 1.7Hz), 6.85-6.79 (2H, m), 6.25 (1H, br.s), 5.13 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.83 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0202】

【実施例137】メチル [4-(2-エチルベンゾチアゾール-6-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート  
(化合物番号472)

融点: 106 - 108°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.95 (1H, d, J=8.4Hz), 7.90 (1H, s), 7.47 (1H, dd, J=8.4, 1.8Hz), 6.83-6.79 (2H, m), 6.25 (1H, br.s), 5.14 (2H, s), 3.76 (3H, s), 3.15 (2H, q, J=7.6Hz), 2.22 (3H, s), 1.47 (3H, t, J=7.6Hz).

【0203】

【実施例138】メチル [4-(2-*t*-ブチルベンゾチアゾール-6-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート  
(化合物番号473)

融点: 153°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.98 (1H, d, J=8.4Hz), 7.92 (1H, s), 7.50-7.49 (2H, m), 6.84-6.82 (2H, m), 6.19 (1H, br.s), 5.15 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s), 1.53 (9H, s).

【0204】

【実施例139】メチル [4-(2-シクロプロピルベンゾチアゾール-6-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート  
(化合物番号474)

融点: 126 - 129°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.90-7.86 (2H, m), 7.47-7.42 (2H, m), 6.83-6.81 (2H, m), 6.19 (1H, br.s), 5.13 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.47-2.32 (1H, m), 2.23 (3H, s), 1.24-1.22 (4H, m).

【0205】

【実施例140】メチル [2-メチル-4-(2-トリフルオロメチルベンゾチアゾール-6-イルメトキシ)フェニル]カルバマート  
(化合物番号475)

融点: 154 - 156°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.20 (1H, d, J=8.6Hz), 8.07 (1H, s), 7.64 (1H, dd, J=8.6, 1.6Hz), 7.51 (1H, br.s), 6.84-6.79 (2H, m), 6.24 (1H, br.s), 5.21 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0206】

【実施例141】メチル [4-(2-(4-クロロフェニル)ベンゾチアゾール-6-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート  
(化合物番号476)

融点: 197 - 198°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.08-7.98 (4H, m), 7.56-7.45 (4H, m), 6.86-6.82 (2H, m), 6.19 (1H, br.s), 5.18 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0207】

【実施例142】メチル [2-メチル-4-(2-メチルベンゾチアゾール-7-イルメトキシ)フェニル]カルバマート  
(化合物番号477)

融点: 126°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.93 (1H, d, J=7.7Hz), 7.50-7.36 (3H, m), 6.86-6.83 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.24 (2H, s), 3.76 (3H, s),



2.85 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0208】

【実施例143】メチル [4-(2-エチルベンゾチアゾール-7-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート  
(化合物番号478)

融点: 109℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.95 (1H, dd, J=7.8, 1.4Hz), 7.50-7.37 (3H, m), 6.87-6.84 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.24 (2H, s), 3.76 (3H, s), 3.17 (2H, q, J=7.6Hz), 2.24 (3H, s), 1.48 (3H, t, J=7.6Hz).

【0209】

【実施例144】メチル [2-メチル-4-(1-メチル-1,2,3-ベンゾトリアゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号481)

物性: ガム状

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.05 (1H, d, J=8.5Hz), 7.61-7.37 (3H, m), 6.87-6.80 (2H, m), 6.23 (1H, br.s), 5.22 (2H, s), 4.30 (3H, s), 3.76 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0210】

【実施例145】メチル [2-メチル-4-(2-メチル-1,2,3-ベンゾトリアゾール-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号483)

物性: ガム状

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.88-7.83 (2H, m), 7.46-7.41 (2H, m), 6.84-6.80 (2H, m), 6.24 (1H, br.s), 5.15 (2H, s), 4.51 (3H, s), 3.75 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0211】

【実施例146】メチル [2-メチル-4-(1-メチル-1,2,3-ベンゾトリアゾール-6-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号485)

物性: ガム状

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.08 (1H, s), 7.61-7.49 (3H, m), 6.84-6.79 (2H, m), 6.24 (1H, br.s), 5.18 (2H, s), 4.30 (3H, s), 3.75 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0212】

【実施例147】メチル [4-(1,2,3-ベンゾチアジアゾール-5-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号488)

融点: 151℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.69 (1H, m), 8.11 (1H, d, J=8.4Hz), 7.76 (1H, dd, J=8.4, 1.3Hz), 7.53 (1H, br.s), 6.87-6.84 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.28 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.25 (3H, s).

【0213】

【実施例148】メチル [4-(1,2,3-ベンゾチアジアゾール-7-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート

(化合物番号490)

融点: 159-162℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.64-8.59 (1H, m), 7.68-7.50 (3H, m), 6.88-6.85 (2H, m), 6.20 (1H, br.s), 5.35 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.25 (3H, s).

【0214】

【実施例149】メチル [4-(キノリン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号491)

融点: 136-139℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.19 (1H, d, J=8.4Hz), 8.08 (1H, d, J=8.1Hz), 7.85-7.51 (4H, m), 7.13 (4H, ABq, J=9.0Hz, Δν=59.4), 6.49 (1H, br.), 5.36 (2H, s), 3.75 (3H, s).

【0215】

【実施例150】メチル [2-メチル-4-(キノリン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号492)

融点: 128-130℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.19 (1H, d, J=8.5Hz), 8.08 (1H, d, J=8.5Hz), 7.85-7.51 (5H, m), 6.87-6.83 (2H, m), 6.20 (1H, br.), 5.36 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.21 (3H, s).

【0216】

【実施例151】メチル [2-メチル-4-(キノリン-3-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号493)

融点: 159℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.97 (1H, d, J=2.2Hz), 8.21 (1H, s), 8.13 (1H, d, J=8.5Hz), 7.84 (1H, d, J=8.2Hz), 7.78-7.69 (1H, m), 7.61-7.54 (2H, m), 6.90-6.86 (2H, m), 6.23 (1H, br.s), 5.24 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0217】

【実施例152】メチル [2-メチル-4-(キノリン-8-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号495)

融点: 119℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.95 (1H, dd, J=4.2, 1.8Hz), 8.19 (1H, dd, J=8.3, 1.7Hz), 7.93 (1H, d, J=7.0Hz), 7.78 (1H, d, J=7.3Hz), 7.59 (1H, d, J=7.2Hz), 7.45 (1H, dd, J=8.3, 4.3Hz), 6.94-6.91 (2H, m), 6.22 (1H, br.s), 5.81 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0218】

【実施例153】メチル [4-(4-クロロ-2-トリフルオロメチルキノリン-6-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号498)

融点: 162-163℃

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.34 (1H, s), 8.26 (1H, d, J=8.7Hz), 7.94 (1H, dd, J=8.7, 1.7Hz), 7.84 (1H, s), 7.52 (1H, br.s), 6.88-6.83 (2H, m), 6.24 (1H, br.s), 5.28 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.25 (3H, s).

【0219】

【実施例154】メチル [4-(4-メトキシキノリン-2-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号499)

融点: 162°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.18 (1H, d, J=8.1Hz), 7.99 (1H, d, J=8.3Hz), 7.75-7.67 (1H, m), 7.53-7.46 (2H, m), 7.02 (1H, s), 6.89-6.86 (2H, m), 6.21 (1H, br.s), 5.29 (2H, s), 4.05 (3H, s), 3.76 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0220】

【実施例155】メチル [2-メチル-4-(キノキサリン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号501)

物性: ガム状

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 9.09 (1H, s), 8.09-8.18 (2H, m), 7.82-7.77 (2H, m), 7.46 (1H, br.s), 6.86-6.81 (2H, m), 6.31 (1H, br.s), 5.37 (2H, s), 3.75 (3H, s), 2.22 (3H, s).

【0221】

【実施例156】メチル [2-メチル-4-(チアゾロ[5,4-c]ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号511)

融点: 190-193°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 9.22 (1H, s), 8.67 (1H, d, J=5.7Hz), 7.91 (1H, d, J=5.7Hz), 7.57 (1H, br.s), 6.89-6.85 (2H, m), 6.23 (1H, br.s), 5.49 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.25 (3H, s).

【0222】

【実施例157】メチル [4-(イミダゾ[2,3-a]ピリジン-3-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号513)

融点: 144°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.17 (1H, d, J=6.9Hz), 7.69-7.63 (2H, m), 7.51 (1H, br.s), 7.29-7.22 (1H, m), 6.91-6.84 (3H, m), 6.28 (1H, br.s), 5.32 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0223】

【実施例158】メチル [4-(3-エトキシカルボニルイミダゾ[2,3-a]ピリジン-5-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号515)

融点: 118-123°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.28 (1H, s), 7.74 (1H, dd, J=8.6, 0.8Hz), 7.43 (1H, dd, J=8.6, 6.9Hz), 7.17 (1H, dd, J=6.9, 0.8Hz), 6.77-6.7

4 (2H, m), 6.18 (1H, br.s), 5.58 (2H, s), 4.19 (2H, q, J=7.0Hz), 3.77 (3H, s), 2.23 (3H, s), 1.31 (3H, t, J=7.0Hz).

【0224】

【実施例159】メチル [2-メチル-4-(オキサゾロ[4,5-b]ピリジン-2-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号516)

融点: 68-70°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 8.61 (1H, dd, J=4.8, 1.2Hz), 7.87 (1H, dd, J=8.3, 1.4Hz), 7.59-7.49 (1H, m), 7.34 (1H, dd, J=4.8, 8.2Hz), 6.93-6.87 (2H, m), 6.18 (1H, br.s), 5.37 (2H, s), 3.76 (3H, s), 2.23 (3H, s).

【0225】

【実施例160】メチル [4-(2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号521)

融点: 133-135°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.45 (1H, br.s), 7.26 (1H, s), 7.15 (1H, d, J=8.1Hz), 6.81-6.76 (2H, m), 6.22 (1H, br.s), 4.92 (2H, s), 4.58 (2H, t, J=8.7Hz), 3.76 (3H, s), 3.21 (2H, t, J=8.7Hz), 2.22 (3H, s).

【0226】

【実施例161】メチル [2-メチル-4-(6-メチル-1,3-ベンゾジオキソラン-5-イルメトキシ)フェニル]カルバマート (化合物番号525)

融点: 115°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.50 (1H, br.s), 6.89 (1H, s), 6.82-6.79 (2H, m), 6.71 (1H, s), 6.19 (1H, br.s), 5.93 (2H, s), 4.89 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.28 (3H, s), 2.24 (3H, s).

【0227】

【実施例162】メチル [4-(2,2-ジフルオロ-1,3-ベンゾジオキソラン-5-イルメトキシ)-2-メチルフェニル]カルバマート (化合物番号526)

融点: 145°C

<sup>1</sup>H-NMRスペクトル(200MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ(ppm): 7.51 (1H, br.s), 7.17-7.02 (3H, m), 6.80-6.77 (2H, m), 6.19 (1H, br.s), 5.00 (2H, s), 3.77 (3H, s), 2.23 (3H, s).

下記製剤例において、「%」とあるのは、重量%を示す。

【0228】

【製剤例1】水和剤

前記実施例1の化合物(化合物番号182番)25部、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム塩2.5部、リグニンスルホン酸カルシウム塩2.5部及び珪藻土70部を、よく混合し、エアーミルで粉碎して、実施例1の化合物を25%含有する水和剤を得た。

【0229】

## 【製剤例2】乳剤

前記実施例2の化合物（化合物番号430番）30部、ドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム塩2.68部、ポリオキシエチレンステアリルエーテル4.92部及びポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルリン酸カルシウム塩0.4部をキシレン62部に溶解し、よく混合して、実施例2の化合物を30%含有する乳剤を得た。

【0230】

## 【製剤例3】粒剤

前記実施例1の化合物（化合物番号182番）5部、ホワイトカーボン（合成シリカ）1部、リグニンスルホン酸カルシウム塩5部、ベントナイト20部及びクレー（炭酸カルシウム）69部を、混合し、エアーミルで粉碎した。粉碎物をニーダーに入れ、水18部を加えてよく練り合せた後、開孔径0.7mmのスクリーンより押し出し造粒した。造粒湿品を、70℃に設定した送風乾燥機中で乾燥し、直径1.00mm～0.30mm区分に整粒して、粒剤を得た。

【0231】

## 【製剤例4】水和顆粒

前記実施例2の化合物（化合物番号430番）80部、ポリアクリル酸重合体ナトリウム塩1.25部、水3.75部、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム塩3部、デキストリン7部及び酸化チタン5部を、エアーミルを用いて粉碎・混合した。次いで、回転ミキサー又は流動床ミキサー中に加え、水を噴霧して顆粒化させた。大部分が1.00mm～0.15mmになったら顆粒を取り出し、送風乾燥機で乾燥後、篩にかけた。オーバーサイズの物質をジェットミルで粉碎し、1.00～0.

15mmの顆粒を得た。

【0232】

## 【製剤例5】水性懸濁液

前記実施例1の化合物（化合物番号182番）25部、ナトリウムジオクチルスルホサクシネート0.7部、リグニンスルホン酸カルシウム塩10部、水44.15部及びプロピレングリコール10.15部を固形粒子が5ミクロン以下の直径に減少されるまで、ボールミル、サンドミル又はローラーミル中で一緒に混合・粉碎した。この粉碎スラリー90部に、0.05%（W/W）キサンタンガム水溶液10部を加えて混合し、水性懸濁液を得た。

【0233】次に、生物試験例を挙げて、具体的にその効果を示す。

【0234】

## 【試験例】

【0235】

## 【試験例1】除草効果及び薬害（水田雑草発芽前処理）

100cm<sup>2</sup>ポットに水田土壌を充填し、休眠覚醒したタイヌビエの種子を表層1cmに混和した。また、2葉期の水稲の苗を移植して湛水状態とし、温室で生育させた。3日後に、製剤例1に準じて調製した水和剤を用いて所定の薬量を湛水土壌処理し、21日後にタイヌビエに対する除草効果及びイネに対する薬害の調査を行った。その結果を表3に示した。なお、除草効果及び薬害は指数で表し、各指数は下記表2の生育抑制率を示し、試験化合物は、実施例番号（例示化合物番号）で示す。

【0236】

【表2】

除草効果及び薬害の指数	生育抑制率（%）
0	0～10
1	11～30
2	31～50
3	51～70
4	71～90
5	91～100

【0237】

【表3】

試験化合物	薬量 (g/a)	水田雑草発芽前処理	
		タイヌビエ	水稲 (除草効果) (薬害)
実施例3番の化合物（例示化合物番号13）	20	5	0
実施例6番の化合物（例示化合物番号26）	20	5	0
実施例7番の化合物（例示化合物番号27）	20	5	0
実施例15番の化合物（例示化合物番号89）	20	5	0

実施例16番の化合物(例示化合物番号90)	20	5	0
実施例20番の化合物(例示化合物番号124)	20	5	0
実施例21番の化合物(例示化合物番号125)	20	5	0
実施例23番の化合物(例示化合物番号135)	20	5	0
実施例27番の化合物(例示化合物番号143)	20	4	0
実施例33番の化合物(例示化合物番号155)	20	5	0
実施例43番の化合物(例示化合物番号182)	20	5	0
実施例45番の化合物(例示化合物番号184)	20	5	0
実施例46番の化合物(例示化合物番号208)	20	5	0
実施例47番の化合物(例示化合物番号209)	20	4	0
実施例49番の化合物(例示化合物番号211)	20	4	0
実施例50番の化合物(例示化合物番号213)	20	5	0
実施例51番の化合物(例示化合物番号214)	20	4	0
実施例52番の化合物(例示化合物番号215)	20	5	0
実施例55番の化合物(例示化合物番号234)	20	5	0
実施例57番の化合物(例示化合物番号240)	20	5	0
実施例61番の化合物(例示化合物番号246)	20	4	0
実施例64番の化合物(例示化合物番号255)	20	4	0
実施例76番の化合物(例示化合物番号286)	20	5	0
実施例78番の化合物(例示化合物番号293)	20	5	0
実施例87番の化合物(例示化合物番号309)	20	5	0
実施例89番の化合物(例示化合物番号324)	20	5	0
実施例104番の化合物(例示化合物番号371)	20	4	0
実施例105番の化合物(例示化合物番号372)	20	5	0
実施例106番の化合物(例示化合物番号373)	20	5	0
実施例109番の化合物(例示化合物番号386)	20	5	0
実施例110番の化合物(例示化合物番号387)	20	5	0
実施例115番の化合物(例示化合物番号412)	20	5	0
実施例122番の化合物(例示化合物番号426)	20	5	0
実施例123番の化合物(例示化合物番号427)	20	5	0
実施例125番の化合物(例示化合物番号431)	20	5	0
実施例129番の化合物(例示化合物番号443)	20	5	0
実施例130番の化合物(例示化合物番号447)	20	5	0
実施例132番の化合物(例示化合物番号455)	20	4	0
実施例133番の化合物(例示化合物番号461)	20	4	0
実施例134番の化合物(例示化合物番号467)	20	4	0
実施例136番の化合物(例示化合物番号471)	20	5	0
実施例137番の化合物(例示化合物番号472)	20	5	0
実施例139番の化合物(例示化合物番号474)	20	5	0
実施例140番の化合物(例示化合物番号475)	20	5	0
実施例144番の化合物(例示化合物番号481)	20	4	0
実施例149番の化合物(例示化合物番号491)	20	5	0
実施例150番の化合物(例示化合物番号492)	20	5	0
実施例156番の化合物(例示化合物番号511)	20	5	0
実施例159番の化合物(例示化合物番号516)	20	5	0
実施例160番の化合物(例示化合物番号521)	20	5	0
<hr/>			
比較化合物A	20	1	0
比較化合物B	20	0	0

【0238】

【試験例2】タイヌビエ2. 5葉期処理

試験例1と同じ方法で、タイヌビエの2. 5葉期に、製剤例1に準じて調製した水和剤を用いて所定の薬量を湛

水処理し、21日後に調査を行なった。その結果を表4に示した(除草効果及び薬害は試験例1と同じ)。

【0239】

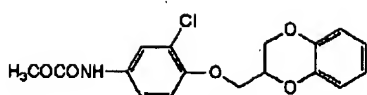
【表4】

試験化合物	薬量 イヌビエ2. 5葉期処理		
	(g/a)	タイヌビエ (除草効果)	水稻 (薬害)
実施例16番の化合物(例示化合物番号90)	10	4	0
	5	2	0
実施例21番の化合物(例示化合物番号125)	10	5	0
	5	4	0
実施例33番の化合物(例示化合物番号155)	10	4	0
	5	2	0
実施例50番の化合物(例示化合物番号213)	10	4	0
	5	2	0
実施例52番の化合物(例示化合物番号215)	10	5	0
	5	4	0
実施例55番の化合物(例示化合物番号234)	10	4	0
	5	2	0
実施例78番の化合物(例示化合物番号293)	10	4	0
	5	2	0
実施例105番の化合物(例示化合物番号372)	10	4	0
	5	3	0
実施例106番の化合物(例示化合物番号373)	10	4	0
	5	3	0
実施例109番の化合物(例示化合物番号386)	10	4	0
	5	2	0
実施例110番の化合物(例示化合物番号387)	10	5	0
	5	4	0
実施例122番の化合物(例示化合物番号426)	10	5	0
	5	4	0
実施例123番の化合物(例示化合物番号427)	10	4	0
	5	3	0
実施例150番の化合物(例示化合物番号492)	10	5	0
	5	4	0
-----			
比較化合物A	10	0	0
	5	0	0
比較化合物B	10	0	0
	5	0	0

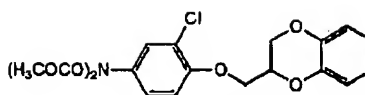
上記表2及び表3中、比較化合物Aは、米国特許4423237に、化合物番号1番として記載されており、又、比較化合物Bは、米国特許4193787に、化合物番号3番として記載されている、それぞれ下記式で表される化合物である。

【0240】

【化7】



比較化合物A



比較化合物B

## 【0241】

【発明の効果】本発明の化合物は、殺草作用を有しており、水田、畑地、果樹園、牧草地、芝生地、森林又は非農耕地の除草剤として使用することができる。

【0242】本発明の化合物は、畑作の茎葉処理及び土壌処理において問題となる種々の雑草に対して、除草活性を示す。

【0243】又、本発明の化合物は、水田において問題となる種々の雑草、例えば、タイヌビエのようなイネ科雑草；コナギ、アゼナ、キカシグサ、ミゾハコベ、のような広葉雑草；タマガヤツリ、ホタルイ、マツバイ、ミズガヤツリのようなカヤツリグサ科雑草に対して除草活性を示し、かつ、イネに対しては問題となる薬害を示さない。

【0244】特に、水田において、雑草の発芽前又は発

芽後に湛水処理することにより、水田の強雑草であるタイヌビエ、ヒメタイヌビエ、ケイヌビエ等のイネ科雑草を強力に防除することができる。一方、水稻に対しては、選択性が大きく、移植水稻は薬害を受けることがないため、処理適用幅が大きいという利点がある。

【0245】更に、畑地、水田のみならず、果樹園、桑畑、非農耕地においても使用することができる。

【0246】本発明の化合物の処理方法としては、通常製剤化して、雑草の発芽前又は出芽後約1ヶ月以内に土壌処理、茎葉処理又は湛水処理する。土壌処理には、土壌表面処理、土壌混和処理等があり、茎葉処理には、植物体の上方からの処理のほか、作物に付着しないように雑草に限って処理する極部処理等があり、湛水処理には、粒剤やフロアブル剤の散布や水面への灌注処理等がある。

フロントページの続き

(51)Int. Cl. <sup>6</sup>	識別記号
A01N 43/42	101
43/56	
43/58	
43/707	
43/80	101
	102
43/824	
43/836	
C07D 209/08	
209/14	
213/61	
213/64	
213/65	
213/70	
215/14	
215/18	
215/22	
231/12	
233/64	103
235/08	
235/16	
239/26	
249/08	514
261/08	
261/10	
263/54	

FI	
A01N 43/42	101
43/56	B
43/58	Z
43/707	
43/80	101
	102
C07D 209/08	
209/14	
213/61	
213/64	
213/65	
213/70	
215/14	
215/18	
215/22	
231/12	Z
233/64	103
235/08	
235/16	
239/26	
249/08	514
261/08	
261/10	
263/54	
271/06	
271/10	

271/06		275/02	
271/10		277/64	
275/02		277/66	
275/03		285/06	
277/64		285/08	
277/66		285/10	
285/06		307/42	
285/08		307/56	
285/10		307/68	
285/12		307/79	
285/125		307/80	
307/42		317/54	
307/56		317/62	
307/68		333/16	
307/79		333/28	
307/80		333/32	
317/54		333/34	
317/62		333/38	
333/16		333/44	
333/28		333/56	
333/32		333/62	
333/34		333/64	
333/38		471/04	105C
333/44		495/04	105A
333/56		A01N 43/82	101A
333/62			104
333/64		C07D 285/12	A
471/04	105		B
495/04	105		D

275/02

(72)発明者 工藤 法明  
滋賀県野洲郡野洲町野洲1041 三共株式会  
社内

(72)発明者 森本 宗嗣  
滋賀県野洲郡野洲町野洲1041 三共株式会  
社内  
(72)発明者 門谷 淳二  
滋賀県野洲郡野洲町野洲1041 三共株式会  
社内